

DOCKET NO.: 278868US0PCT

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

IN RE APPLICATION OF: Nobuaki ETO, et al.

SERIAL NO.: NEW U.S. PCT APPLICATION

FILED: HERewith

INTERNATIONAL APPLICATION NO.: PCT/JP04/04427

INTERNATIONAL FILING DATE: March 29, 2004

FOR: COMPOUND INHIBITING IN VIVO PHOSPHORUS TRANSPORT AND MEDICINE
CONTAINING THE SAME

REQUEST FOR PRIORITY UNDER 35 U.S.C. 119
AND THE INTERNATIONAL CONVENTION

Commissioner for Patents
Alexandria, Virginia 22313

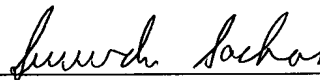
Sir:

In the matter of the above-identified application for patent, notice is hereby given that the applicant claims as priority:

<u>COUNTRY</u>	<u>APPLICATION NO</u>	<u>DAY/MONTH/YEAR</u>
Japan	2003-089173	27 March 2003

Certified copies of the corresponding Convention application(s) were submitted to the International Bureau in PCT Application No. PCT/JP04/04427. Receipt of the certified copy(s) by the International Bureau in a timely manner under PCT Rule 17.1(a) has been acknowledged as evidenced by the attached PCT/IB/304.

Respectfully submitted,
OBLON, SPIVAK, McCLELLAND,
MAIER & NEUSTADT, P.C.



Norman F. Oblon
Attorney of Record
Registration No. 24,618
Surinder Sachar
Registration No. 34,423

Customer Number

22850

(703) 413-3000
Fax No. (703) 413-2220
(OSMMN 08/03)

29. 3. 2004

日本国特許庁
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application: 2003年 3月27日

出願番号
Application Number: 特願2003-089173
[ST. 10/C]: [JP 2003-089173]

出願人
Applicant(s): 麒麟麦酒株式会社

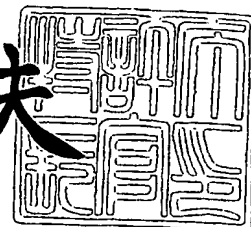


PRIORITY
DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2004年 4月28日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

今井康夫



出証番号 出証特2004-3036724

【書類名】 特許願
【整理番号】 14129301
【提出日】 平成15年 3月27日
【あて先】 特許庁長官殿
【国際特許分類】 C07D239/00
【発明の名称】 生体内リン輸送を阻害する化合物およびそれを含んでなる医薬
【請求項の数】 50

【発明者】

【住所又は居所】 群馬県高崎市宮原町 3 番地 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内

【氏名】 江 藤 伸 晃

【発明者】

【住所又は居所】 群馬県高崎市宮原町 3 番地 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内

【氏名】 長 尾 里 佳

【発明者】

【住所又は居所】 群馬県高崎市宮原町 3 番地 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内

【氏名】 宮 崎 哲 子

【特許出願人】

【識別番号】 000253503

【住所又は居所】 東京都中央区新川二丁目 10 番 1 号

【氏名又は名称】 麒麟麦酒株式会社

【代理人】

【識別番号】 100075812

【弁理士】

【氏名又は名称】 吉 武 賢 次

【選任した代理人】

【識別番号】 100091487

【弁理士】

【氏名又は名称】 中 村 行 孝

【選任した代理人】

【識別番号】 100094640

【弁理士】

【氏名又は名称】 紺 野 昭 男

【選任した代理人】

【識別番号】 100107342

【弁理士】

【氏名又は名称】 横 田 修 孝

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 087654

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 図面 1

【物件名】 要約書 1

【プルーフの要否】 要

【書類名】 明細書

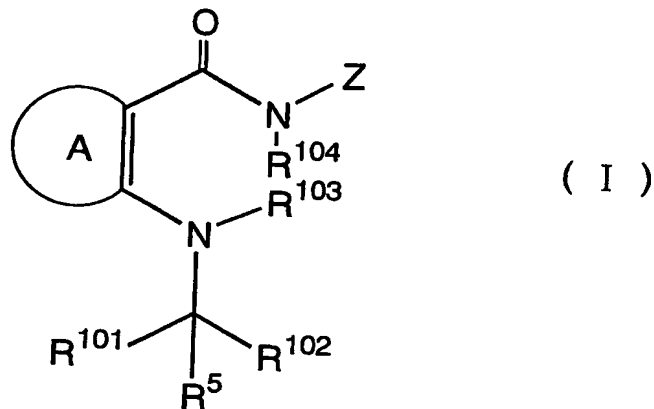
【発明の名称】 生体内リン輸送を阻害する化合物およびそれを含んでなる医薬

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物。

【化 1】



(上記式中、

Aは、5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分を表し、この炭素環部分および複素環部分は

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c) C₁～6 アルキル基；
- (d) C₁～6 アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；または
- (j) アミノ基

により置換されていてもよく、

(c) C₁-6 アルキル基、(d) C₁-6 アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および(h) アルキルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C₁-6 アルコキシ基、(5) C₁-6 アルキルチオ基、(6) C₁-6 アルキルスルフォニル基、(7) モノ-またはジ- C₁-6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁-6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルフォニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基 (このアミノ基は更に C₁-6 アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、C₁-6 アルキル基、C₁-6 アルコキシ基、または C₁-6 アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよく、

この炭素環部分および複素環部分が2つの(c) C₁-6 アルキル基により置換されている場合には、これらのアルキル基は一緒になって C₃-5 アルキレン鎖を形成してもよく、

R⁵ は、C₁-6 アルキル基、アリール基、C₁-6 アルコキシ基、アリールオキシ基、C₁-6 アルキルアミノ基、アリールアミノ基、C₁-6 アルキルチオ基、アリールチオ基、C₃-7 シクロアルキル基、または複素環式基を表し、R⁵ が表す C₁-6 アルキル基、アリール基、C₁-6 アルコキシ基、アリールオキシ基、C₁-6 アルキルアミノ基、アリールアミノ基、C₁-6 アルキルチオ基、アリールチオ基、C₃-7 シクロアルキル基、または複素環式基は、同一または異なってもよく、下記基:

(I) ハロゲン原子;

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C₁-6 アルコキシ基、(5) C₁-6 アルキルチオ基、(6) C₁-6 アルキルスルフィニル基、(7) C₁-6 アルキルスルホニル基、(8) モノ-またはジ- C₁-6 アルキルアミノ基、(8') 複素環式基により置換されたアミノ基 (この複素環式基は更に C₁-6 アルキル基により置換されていてもよい)、(9) C₁-6 アルキルカルボニルオキシ基、(10) C₁-6 アルキルカルボニルチオ基、(11) C₁-6 アルキルカルボニル

アミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)C₁-6アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18)C₁-6アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19)C₁-6アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20)C₁-6アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21)カルボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')Het-S(=O)_j- (Hetは複素環式基を表し、jは0、1、または2を表し、Hetはモノ-またはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよいC₁-6アルキル基

(ここで、(4)C₁-6アルコキシ基、(5)C₁-6アルキルチオ基、(6)C₁-6アルキルスルフィニル基、および(7)C₁-6アルキルスルホニル基のアルキル部分は、ハロゲン原子、C₁-6アルキル基、C₁-6アルコキシ基、C₁-6アルキルチオ基、モノ-またはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシル基、-S(=O)₂(-OH)、C₁-6アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、C₁-6アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基 (この複素環式基はモノ-またはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノ-またはジ-C₁-6アルキルアミノ基において、ジ-C₁-6アルキ

ルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよいC₁－6アルキル；C₁－6アルコキシ基；C₁－6アルキルチオ基；モノーまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基（アミノ基上の1または2つのアルキル基は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更にC₁－6アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ－C₁－6アルキルカルバモイルメチル基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシル基；C₁－6アルコキシ－またはアリールオキシ－カルボニル基；C₁－6アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい）；または複素環式基により更に置換されていてもよい）；

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁－6アルコキシ基；

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁－6アルキルチオ基；

(V) C₃－7シクロアルキル基；

(VI) アリール基；

(VII) アリールオキシ基；

(VIII) C₁－6アルキルカルボニルアミノ基；

(IX) C₁－6アルキルカルボニルオキシ基；

(X) 水酸基；

(XI) ニトロ基；

(XII) シアノ基；

(XIII) アミノ基；

(XIV) モノーまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；

(XV) アリールアミノ基;

(XVI) C₁ - 6 アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基;

(XVII) C₁ - 6 アルキル-またはアリール-ウレイド基;

(XVIII) C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基;

(XIX) C₁ - 6 アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基;

(XX) C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基;

(XXI) アシル基;

(XXII) カルボキシ基;

(XXIII) カルバモイル基;

(XXIV) モノ-またはジ-アルキルカルバモイル基;

(XXV) 複素環式基;

(XXVI) アルキル-またはアリール-スルホニル基;

(XXVII) C₂ - 6 アルケニルオキシ基; または

(XXVIII) C₂ - 6 アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

Z は

【化 2】



を表し、

ここで、R⁶ および R⁷ は、同一または異なってもよく、水素原子、C₁ - 6 アルキル基、C₂ - 6 アルケニル基、C₂ - 6 アルキニル基、アリール基、アリール C₁ - 6 アルキル基、アリール C₂ - 6 アルケニル基、または複素環式基を表し、C₁ - 6 アルキル基、アリール基、アリール C₁ - 6 アルキル基、アリール C₂ - 6 アルケニル基、および複素環式基は、同一または異なっても

よく、下記基:

(I) ハロゲン原子;

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、(5)水酸基により置換されていてもよいC₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフィニル基、(7)C₁ - 6 アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1 ~ 3 個の異種原子を含んでもよい)、(9)C₁ - 6 アルキルカルボニルオキシ基、(10)C₁ - 6 アルキルカルボニルチオ基、(11)C₁ - 6 アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)C₁ - 6 アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18)C₁ - 6 アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19)C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20)C₁ - 6 アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21)カルボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')Het-S- (Hetは複素環式基を表す)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよいC₁ - 6 アルキル基;

(III) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、(5)水酸基により置換されていてもよいC₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフィニル基、(7)C₁ - 6 アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1 ~ 3 個の異種原子を含んでもよい)、(9)C₁ - 6 アルキルカルボニルオキシ基、(10)C₁ - 6 アルキルカルボニルチオ基、(11)C₁ - 6 アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)C₁ - 6 アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18)C₁ - 6 アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19)C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20)C₁ - 6 アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21)カル

ボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')Het-S- (Hetは複素環式基を表す)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよいC₁-6アルコキシ基；

(IV)ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁-6アルキルチオ基；

(V) C₃-7シクロアルキル基；

(VI)アリール基；

(VII)アリールオキシ基；

(VIII) C₁-6アルキルカルボニルアミノ基；

(VIX) C₁-6アルキルカルボニルオキシ基；

(X)水酸基；

(XI)ニトロ基；

(XII)シアノ基；

(XIII)アミノ基；

(XIV)モノーまたはジ- C₁-6アルキルアミノ基 (ジ- C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) ；

(XV)アリールアミノ基；

(XVI) C₁-6アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基；

(XVII) C₁-6アルキル-またはアリール-ウレイド基；

(XVIII) C₁-6アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基；

(XIX) C₁-6アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基；

(XX) C₁-6アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基；

(XXI)アシル基；

(XXII)カルボキシル基；

(XXIII)カルバモイル基；

(XXIV)モノーまたはジ-アルキルカルバモイル基；

(XXV)複素環式基；

(XXVI)アルキル-またはアリール-スルホニル基；または

(XXVII) C₂ - 6 アルケニルオキシ基 ; または

(XXVIII) C₂ - 6 アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

R¹⁷ は水素原子を表し、

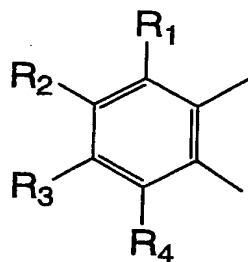
R¹⁰¹ と R¹⁰² が一緒になって =O を表し、かつ R¹⁰³ および R¹⁰⁴ が水素原子を表すか、あるいは

R¹⁰¹ と R¹⁰⁴ が一緒になって結合を表し、かつ R¹⁰² と R¹⁰³ とが一緒になって結合を表す。)

【請求項 2】

A が式 (IIa) を表す、請求項 1 に記載の化合物。

【化 3】



(IIa)

(上記式中、R¹、R²、R³、および R⁴ は、同一または異なっているとしてもよく、

- (a) ハロゲン原子 ;
- (b) 水酸基 ;
- (c) C₁ - 6 アルキル基 ;
- (d) C₁ - 6 アルコキシ基 ;
- (e) アリール基 ;
- (f) アリールオキシ基 ;
- (g) アリールチオ基 ;
- (h) アルキルチオ基 ;
- (i) ニトロ基 ;
- (j) アミノ基 ; または

(k)水素原子

を表し、

(c) C₁ - 6 アルキル基、(d) C₁ - 6 アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および(h) アルキルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C₁ - 6 アルコキシ基、(5) C₁ - 6 アルキルチオ基、(6) C₁ - 6 アルキルスルフォニル基、(7) モノ-またはジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルフォニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基 (このアミノ基は更に C₁ - 6 アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、C₁ - 6 アルキル基、C₁ - 6 アルコキシ基、または C₁ - 6 アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい)

【請求項3】

R¹、R³、およびR⁴が、同一または異なってもよく、
水素原子；

ハロゲン原子；

C₁ - 6 アルキル基 (このアルキル基は、C₁ - 6 アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；

アリール基 (このアリール基は、C₁ - 6 アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；

C₁ - 6 アルコキシ基 (このアルコキシ基は、C₁ - 6 アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；または

アリールオキシ基 (このアリールオキシ基は、C₁ - 6 アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表し、

R²が

水素原子；

ハロゲン原子；

水酸基；

C₁ - 6 アルキル基（このアルキル基は、(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、(5)C₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフォニル基、(7)モノまたはジC₁ - 6 アルキルアミノ基（ジ-C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更にC₁ - 6 アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、C₁ - 6 アルキル基、C₁ - 6 アルコキシ基、またはC₁ - 6 アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい）；または

C₁ - 6 アルコキシ基（このアルコキシ基は、(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、(5)C₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフォニル基、(7)モノまたはジC₁ - 6 アルキルアミノ基（ジ-C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子により置換されていてもよい）

を表す

請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R¹、R²、R³、およびR⁴が、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよいC₁ - 6 アルキル基；または置換基を有してもよいC₁ - 6 アルコキシ基を表す、請求項2に記載の化合物。

【請求項5】

R¹、R²、R³、およびR⁴が水素原子を表す、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R¹ および R⁴ が水素原子を表し、R² および R³ のいずれか一方がハロゲン

原子；水酸基；置換基を有してもよいC₁－6アルキル基；置換基を有してもよいC₁－6アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表す、請求項4に記載の化合物。

【請求項7】

R¹ およびR⁴ が水素原子を表し、R² およびR³ が、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよいC₁－6アルキル基；置換基を有してもよいC₁－6アルコキシ基を表す、請求項4に記載の化合物。

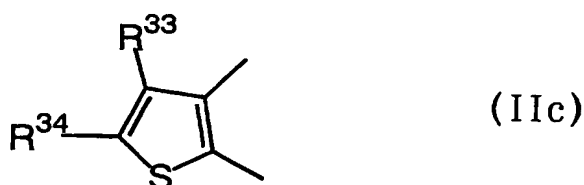
【請求項8】

Aが式 (IIb) または式 (IIc) を表す、請求項1に記載の化合物。

【化4】



【化5】



(上記式中、R³¹、R³²、R³³、およびR³⁴は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；またはC₁－6アルキル基（このアルキル基は(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁－6アルコキシ基、(5)C₁－6アルキルチオ基、(6)C₁－6アルキルスルフォニル基、(7)モノーまたはジ-C₁－6アルキルアミノ基（ジ-C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)ア

リールアミノ基（このアミノ基は更にC₁-6アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、C₁-6アルキル基、C₁-6アルコキシ基、またはC₁-6アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい）を表し、R³¹とR³²とは一緒になってC₃-5アルキレン鎖を形成してもよく、またR³³とR³⁴とは一緒になってC₃-5アルキレン鎖を形成してもよい）

【請求項 9】

Aが式 (IIb) を表し、R³¹ および R³² が水素原子を表すか、または R³¹ および R³² のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよいC₁-6アルキル基を表し、あるいはR³¹とR³²とが一緒になってC₃-5アルキレン鎖を形成している、請求項8に記載の化合物。

【請求項 10】

Aが式 (IIc) を表し、R³³ および R³⁴ が水素原子を表すか、または R³³ および R³⁴ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよいC₁-6アルキル基を表し、あるいはR³³とR³⁴とが一緒になってC₃-5アルキレン鎖を形成している、請求項8に記載の化合物。

【請求項 11】

R⁵が、置換基を有してもよいC₅-7シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 12】

アリール基がフェニル基またはナフチル基である、請求項11に記載の化合物。

【請求項 13】

複素環式基が、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、およびピリミジル基から選択される、請求項11に記載の化合物。

【請求項 14】

R⁵が、C₅-7シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、およびピリミジル基から選択される環状基（この

環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁－6アルキル基；ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁－6アルコキシ基；または水酸基により置換されていてもよい）を表す、請求項1に記載の化合物。

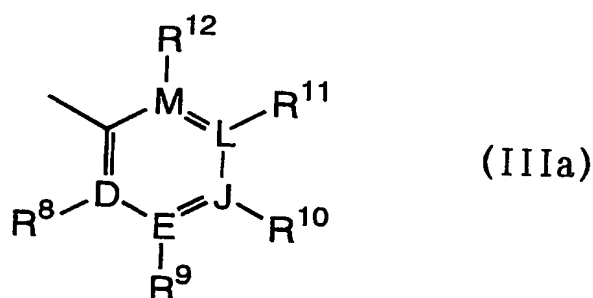
【請求項15】

R⁵が、C₅－7シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、およびピリミジル基から選択される環状基（この環状基は、C₁－6アルキルにより置換されていてもよく、このアルキル基は、置換されていてもよいC₁－6アルコキシ基、置換されていてもよいC₁－6アルキルチオ基、置換されていてもよいC₁－6アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいC₁－6アルキルスルホニル基、または置換されていてもよいモノーまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）により更に置換されていてもよい）を表す、請求項1に記載の化合物。

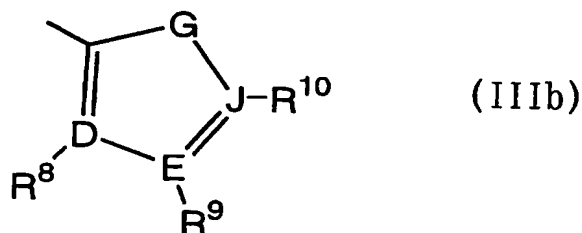
【請求項16】

R⁵が、式(IIIa)、式(IIIb)、または式(IIIc)の基を表す、請求項1に記載の化合物。

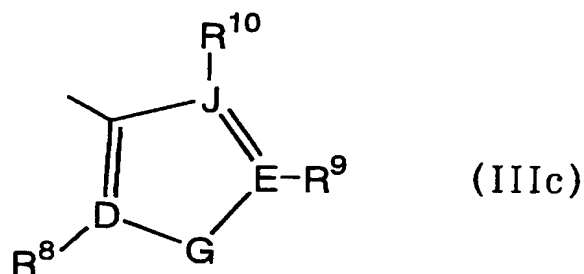
【化6】



【化7】



【化8】



(上記式中、

D、E、J、L、およびMは、同一または異なっていてもよく、炭素原子または窒素原子を表し、

Gは酸素原子または硫黄原子を表し、

R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²は、同一または異なっていてもよく、

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁－6アルコキシ基、(5)C₁－6アルキルチオ基、(6)C₁－6アルキルスルフィニル基、(7)C₁－6アルキルスルホニル基、(8)モノーまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基、(8')複素環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更にC₁－6アルキル基により置換されていてもよい）、(9)C₁－6アルキルカルボニルオキシ基、(10)C₁－6アルキルカルボニルチオ基、(11)C₁－6アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)C₁－6アルキル－またはアリール－スルホニルアミノ基、(18)C₁－6アルキル－またはア

リールーウレイド基、(19) C_1-6 アルコキシ―またはアリールオキシ―カルボニルアミノ基、(20) C_1-6 アルキルアミノ―またはアリールアミノ―カルボニルオキシ基、(21) カルボキシル基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23') $Het-S(=O)_j-$ (Het は複素環式基を表し、 j は 0、1、または 2 を表し、 Het はモノ―またはジ― C_1-6 アルキルアミノ基 (ジ― C_1-6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24) シアノ基、および(25) ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい C_1-6 アルキル基

(ここで、(4) C_1-6 アルコキシ基、(5) C_1-6 アルキルチオ基、(6) C_1-6 アルキルスルフィニル基、および(7) C_1-6 アルキルスルホニル基のアルキル部分は、水素原子、ハロゲン原子、 C_1-6 アルキル基、 C_1-6 アルコキシ基、 C_1-6 アルキルチオ基、モノ―またはジ― C_1-6 アルキルアミノ基 (ジ― C_1-6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシル基、 $-S(=O)_2(-OH)$ 、 C_1-6 アルコキシ―またはアリールオキシ―カルボニル基、 C_1-6 アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基 (この複素環式基はモノ―またはジ― C_1-6 アルキルアミノ基 (ジ― C_1-6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノ―またはジ― C_1-6 アルキルアミノ基において、ジ― C_1-6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよい C_1

—6 アルキル；C₁—6 アルコキシ基；C₁—6 アルキルチオ基；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルアミノ基（アミノ基上の1または2つのアルキル基は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更にC₁—6 アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルカルバモイルメチル基（ジ—C₁—6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシル基；C₁—6 アルコキシ—またはアリールオキシ—カルボニル基；C₁—6 アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい）；または複素環式基により更に置換されていてもよい）；

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁—6 アルコキシ基；

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁—6 アルキルチオ基；

(V) C₃—7 シクロアルキル基；

(VI) アリール基；

(VII) アリールオキシ基；

(VIII) C₁—6 アルキルカルボニルアミノ基；

(VIX) C₁—6 アルキルカルボニルオキシ基；

(X) 水酸基；

(XI) ニトロ基；

(XII) シアノ基；

(XIII) アミノ基；

(XIV) モノーまたはジ—C₁—6 アルキルアミノ基（ジ—C₁—6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；

(XV) アリールアミノ基；

(XVI) C₁—6 アルキル—またはアリール—スルホニルアミノ基；

(XVII) C₁—6 アルキル—またはアリール—ウレイド基；

(XVIII) C₁ - 6 アルコキシまたはアリールオキシカルボニルアミノ基;

(XIX) C₁ - 6 アルキルアミノまたはアリールアミノカルボニルオキシ基;
;

(XX) C₁ - 6 アルコキシまたはアリールオキシカルボニル基;

(XXI) アシル基;

(XXII) カルボキシ基;

(XXIII) カルバモイル基;

(XXIV) モノまたはジアルキルカルバモイル基;

(XXV) 複素環式基;

(XXVI) アルキルまたはアリールスルホニル基;

(XXVII) C₂ - 6 アルケニルオキシ基;

(XXVIII) C₂ - 6 アルキニルオキシ基; または

(XXIX) 水素原子

を表し、

D、E、J、L、またはMが窒素原子を表す場合、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²はそれぞれ存在しないか、あるいは窒素原子と一緒になってN-オキシド (N→O) を形成していてもよい。)

【請求項 17】

R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²が、同一または異なっているもよく、

水素原子;

ハロゲン原子;

ヒドロキシメチル基;

ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁ - 6 アルキル基; または

ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁ - 6 アルコキシ基

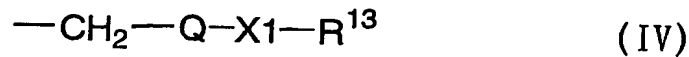
を表す、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²が表すことがある置換されたC₁ - 6 アルキル基が

式 (IV) の基

【化 9】



(上記式中、

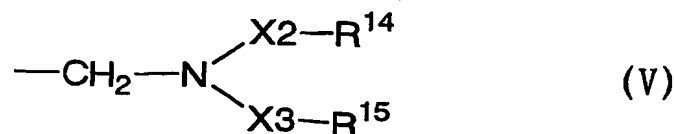
Qは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、またはスルフォニル基を表し、

X¹は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

R¹³は、水素原子、ハロゲン原子、C₁～6アルキル基、C₁～6アルコキシ基、C₁～6アルキルチオ基、モノーまたはジ-C₁～6アルキルアミノ基 (ジ-C₁～6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシ基、-S(=O)₂(-OH)、C₁～6アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、C₁～6アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基 (この複素環式基はモノーまたはジ-C₁～6アルキルアミノ基 (ジ-C₁～6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) ;

または式 (V) の基

【化 10】



(上記式中、

X₂ は結合または炭素数 1～5 の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

X₃ は結合または炭素数 1～5 の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

R¹⁴ および R¹⁵ は、同一または異なっているいてもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基により置換されているいてもよい C₁—6 アルキル；C₁—6 アルコキシ基；C₁—6 アルキルチオ基；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルアミノ基（アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基は、水酸基により置換されているいてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更に C₁—6 アルキル基により置換されているいてもよい）；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルカルバモイルメチル基（ジ—C₁—6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているいてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいるいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されているいてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシル基；C₁—6 アルコキシ—またはアリールオキシ—カルボニル基；C₁—6 アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されているいてもよい）；または複素環式基を表し、但し、X₂ が結合を表す場合には R¹⁴ は水素原子を表し、X₃ が結合を表す場合には R¹⁵ は水素原子を表し、あるいは

R¹⁴ および R¹⁵ はそれらが結合している窒素原子と一緒になって複素環式基を形成しているてもよく、この複素環式基は R¹⁴ および R¹⁵ が結合している窒素原子以外に更に 1～3 個の異種原子を含んでいるてもよく、この複素環式基は更に水酸基；水酸基により置換されているてもよい C₁—6 アルキル；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルアミノ基（ジ—C₁—6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいるてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されているてもよい）；飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルカルバモイルメチル基（ジ—C₁—6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいるてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されているてもよい）；フェニル基；

または酸素原子により置換されていてもよい。)

を表し、残りの基が水素原子を表す、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 19】

D、E、J、L、および M が炭素原子を表す、請求項 16～18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

D、E、J、L、および M のいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す、請求項 16～18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

R⁶ が、水素原子；置換基を有してもよい C₁－6 アルキル基；または置換基を有していてもよいアリール基を表し、R⁷ が、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C₁－6 アルキル基、置換を有していてもよいアリール C₂－6 アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表す、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 22】

R⁶ が、水素原子；ハロゲン原子または C₁－6 アルコキシ基により置換されていてもよい C₁－6 アルキル基；またはハロゲン原子、C₁－6 アルキル基、または C₁－6 アルコキシ基により置換されていてもよいアリール基を表す、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

R⁶ が、水素原子または C₁－6 アルキル基を表す、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 24】

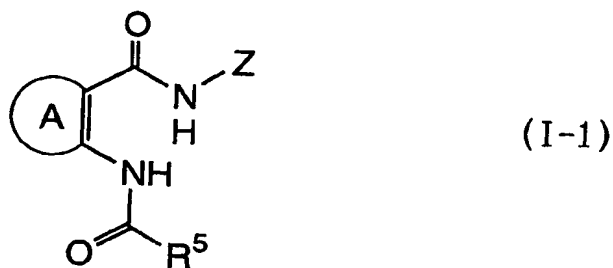
R⁷ が、フェニル基、ナフチル基、フリル基、ピロリル基、およびチエニル基から選択される環状基（この環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよい C₁－6 アルキル基；C₁－6 アルコキシ基（このアルコキシ基は、ハロゲン原子；アリールオキシ基（このアリールオキシ基はハロゲン原子及び C₁－6 アルキル基により置換されてもよい）；C₁－6 アルコキシ基（このアルコキシ基は、モノまたはジ C₁－6 アルキルアミン（ジ C₁－6 アルキ

ルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい) ; ハロゲン原子により置換されていてもよい) ; アリールチオ基 (このアリールチオ基はハロゲン原子及びC₁～6アルキル基により置換されていてもよい) ; C₁～6アルキルチオ基 (このアルキルチオ基は、モノまたはジC₁～6アルキルアミン (ジ-C₁～6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい) ; ハロゲン原子により置換されていてもよい) ; アリールアミノ基 (このアリールアミノ基はさらにC₁～6アルキルによって置換されていてもよい) ; モノまたはジC₁～6アルキルアミン (ジ-C₁～6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい) により置換されていてもよい) ; 水酸基; モノ-またはジ-C₁～6アルキルアミノ基 (ジ-C₁～6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい) ; ニトロ基; C₂～6アルケニルオキシ基; またはC₂～6アルキニルオキシ基により置換されていてもよい) を表す、請求項21～23のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項25】

式(I) が式(I-1) で表される、請求項1に記載の化合物。

【化11】

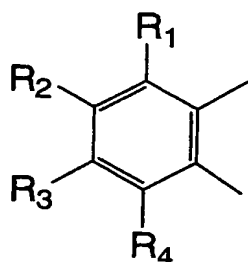


(上記式中、A、R⁵、およびZは請求項1において定義された内容と同義である。)

【請求項26】

Aが式(IIa) :

【化 3】



(IIa)

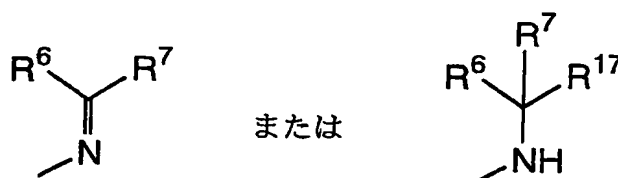
(上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 は、請求項 2 の式 (IIa) において定義された内容と同義である。)

であり、

R^5 が、置換基を有してもよい C 5-7 シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、

Z が下記基：

【化 2】



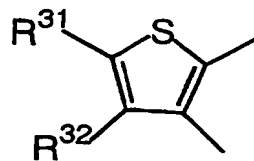
(上記式中、 R^6 が水素原子または C 1-6 アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C 1-6 アルキル基、置換を有していてもよいアリール C 2-6 アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

A が式 (IIb)：

【化 4】



(IIb)

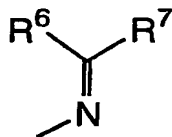
(上記式中、 R^{31} および R^{32} は、請求項 8 の式 (IIb) において定義された内容と同義である。)

であり、

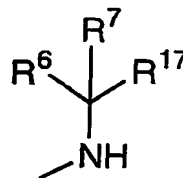
R^5 が、置換基を有してもよい C 5-7 シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、

Z が下記基：

【化 2】



または



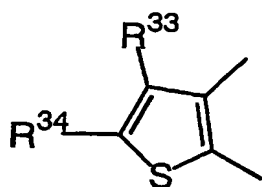
(上記式中、 R^6 が水素原子または C 1-6 アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C 1-6 アルキル基、置換を有していてもよいアリール C 2-6 アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 28】

A が式 (IIc) :

【化5】



(IIc)

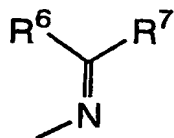
(上記式中、R³³およびR³⁴は、請求項8の式(IIc)において定義された内容と同義である。)

であり、

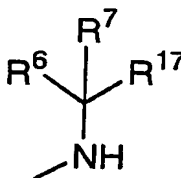
R⁵が、置換基を有してもよいC₅–7シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

Zが下記基：

【化2】



または



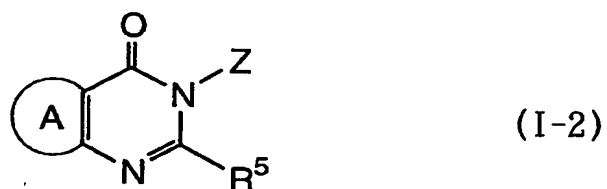
(上記式中、R⁶が水素原子またはC₁–6アルキル基を表し、R⁷が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC₁–6アルキル基、置換を有していてもよいアリールC₂–6アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、R¹⁷が水素原子を表す)

を表す、請求項25に記載の化合物。

【請求項29】

式(I)が式(I-2)で表される、請求項1に記載の化合物。

【化 12】

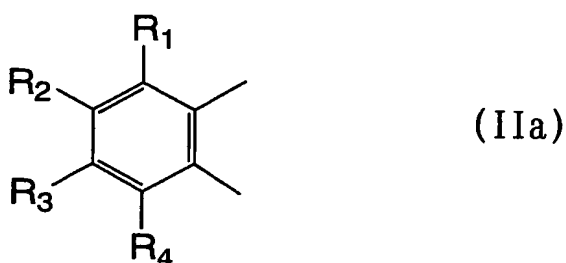


(上記式中、A、R⁵、およびZは請求項1において定義された内容と同義である。)

【請求項30】

Aが式(IIa)：

【化 3】



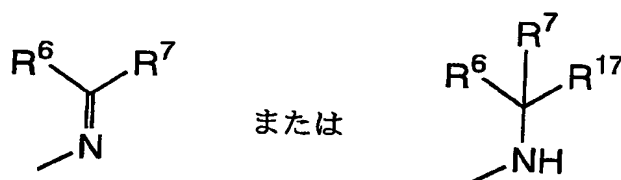
(上記式中、R¹、R²、R³、およびR⁴は、請求項2の式(IIa)において定義された内容と同義である。)

であり、

R⁵が、置換基を有してもよいC₅－7シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

Zが下記基：

【化2】



(上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C_{1-6} アルキル基、置換を有していてもよいアリール C_{2-6} アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

A が式 (IIb) :

【化4】



(IIb)

(上記式中、 R^{31} および R^{32} は、請求項 8 の式 (IIb) において定義された内容と同義である。)

であり、

R^5 が、置換基を有してもよい C_{5-7} シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、

Z が下記基：

【化 2】



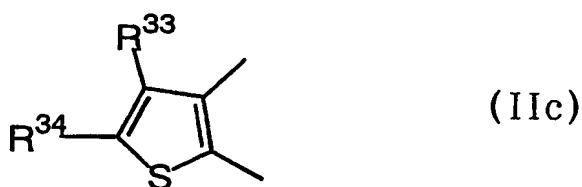
(上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C_{1-6} アルキル基、置換を有していてもよいアリール C_{2-6} アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 32】

A が式 (IIc) :

【化 5】



(IIc)

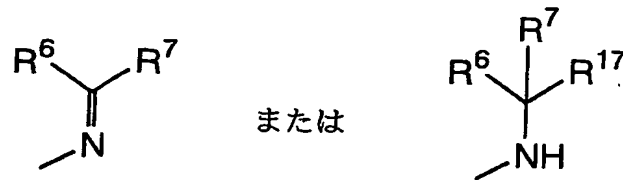
(上記式中、 R^{33} および R^{34} は、請求項 8 の式 (IIc) において定義された内容と同義である。)

であり、

R^5 が、置換基を有してもよい C_{5-7} シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、

Z が下記基：

【化 2】



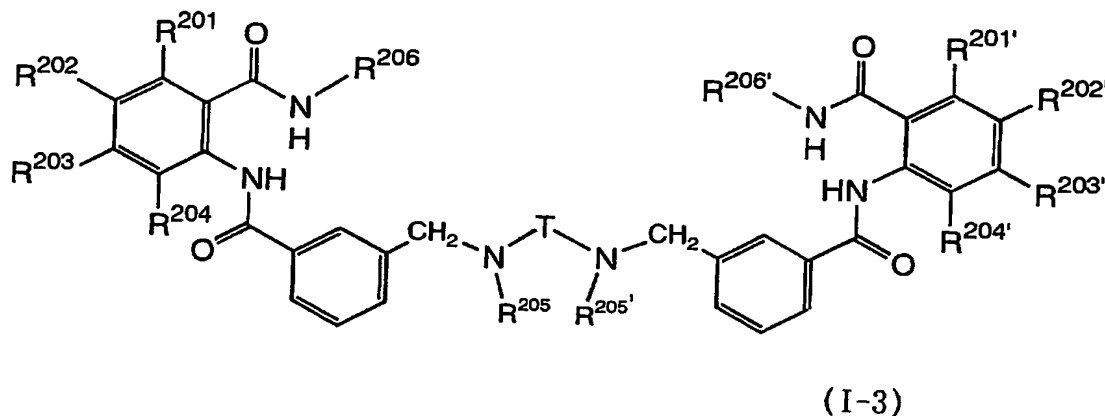
(上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C_{1-6} アルキル基、置換を有していてもよいアリール C_{2-6} アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 33】

式 (I-3) の化合物またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物。

【化 13】



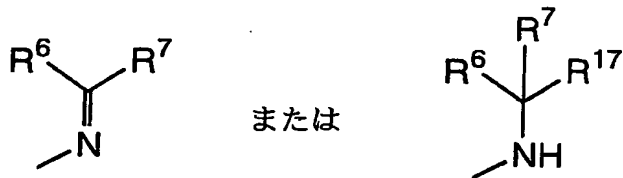
(上記式中、 R^{201} 、 R^{202} 、 R^{203} 、 R^{204} 、 $R^{201'}$ 、 $R^{202'}$ 、 $R^{203'}$ 、および $R^{204'}$ は、同一または異なってもよく、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、または C_{1-6} アルコキシ基を表し、

R^{205} および $R^{205'}$ は、同一または異なってもよく、水素原子また

はC₁ - 6 アルキル基を表し、

R²⁰⁶ および R^{206'} は、同一または異なっているとしてもよく、

【化2】



(上記式中、R⁶ が水素原子またはC₁ - 6 アルキル基を表し、R⁷ がアリール基または飽和または不飽和の5または6員複素環式基（アリール基および複素環式基はハロゲン原子またはハロゲン原子により置換されていてもよいC₁ - 6 アルキル基を表す）

を表し、

TはC₂ - 8 アルキレン鎖を表す)

【請求項34】

請求項1～33のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を有効成分として含んでなる、医薬組成物。

【請求項35】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上または予防上有効である疾患の予防または治療に用いることができる、請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項36】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上または予防上有効である疾患が、高リン血症である、請求項35に記載の医薬組成物。

【請求項37】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上または予防上有効である疾患が、腎不全および慢性腎不全である、請求項35に記載の医薬組成物。

【請求項38】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上または予防上有効である疾患が、二次性副甲状腺機能亢進症および原発性副甲状腺機能亢進症並びにこれら

に関連する疾患である、請求項 35 に記載の医薬組成物。

【請求項 39】

二次性副甲状腺機能亢進症に関連する疾患が、腎性骨異常栄養症、PTH 増加またはビタミン D 低下により生ずる中枢・末梢神経障害、貧血、心筋障害、高脂血症、糖代謝異常、皮膚掻痒、腱断裂、性機能異常、筋肉障害、皮膚虚血性潰瘍、成長遅延、心伝導障害、肺拡張障害、免疫不全、骨・関節痛、骨変形、または骨折である、請求項 38 に記載の医薬組成物。

【請求項 40】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウム・リン代謝異常疾患（例えば、代謝性骨疾患）である、請求項 35 に記載の医薬組成物。

【請求項 41】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患である、請求項 35 に記載の医薬組成物。

【請求項 42】

カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患が、透析患者における心血管系の石灰化、加齢による動脈硬化、糖尿病性血管症、軟部組織石灰化、転移性石灰化、異所性石灰化、red eye、関節痛、筋肉痛、皮膚掻痒、心伝導障害、肺拡張障害、狭心症、心筋梗塞、または心雑音や弁膜症による心不全である、請求項 41 に記載の医薬組成物。

【請求項 43】

請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を含んでなる、血清リン濃度低下剤。

【請求項 44】

請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を含んでなる、リン酸輸送阻害剤。

【請求項 45】

血清リン低下作用またはリン酸輸送の障害が治療上有効である疾患の予防また

は治療に用いられる医薬の製造のための、請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 46】

血清リン濃度低下剤の製造のための、請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 47】

リン酸輸送阻害剤の製造のための、請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 48】

請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療方法。

【請求項 49】

請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、血流中の血清リン濃度を低下させる方法。

【請求項 50】

請求項 1～33 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、生体内におけるリン酸輸送を阻害する方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の背景】

発明の分野

本発明は、血清中のリン濃度を抑制する化合物に関し、より詳細には高リン血症の予防および治療に有用な化合物に関する。

【0002】

関連技術

血清リン濃度は腸管からのリン酸の吸収と、細胞内および骨への蓄積、腎臓での原尿への濾過とその後の尿細管での再吸収のバランスにより規定されている。血清リン濃度が 5.0 mg/dl 以上となる場合は高リン血症といわれ、主に末期腎不全や、透析期患者で顕著に表れてくる病態である。その主な原因は腎機能の廃絶に伴うリン酸排泄の低下であるが、投与されるビタミンDによる腸管からのリン酸吸収の増加も関与が示唆されている。高リン血症は二次的に低カルシウム血症を招くため二次的な副甲状腺機能亢進症を誘発し、これはさらに腎性骨栄養症の主要因ともなる。

【0003】

従来、これら病態の改善には腸管からのリン酸の吸収を減少させるためにリン酸含有量の少ない食事の摂取や食物中のリン酸を吸着させる機能を有するリン酸吸着剤の使用が行われてきた。しかし、リン酸含有量の少ない食事は他の栄養分の摂取不足による栄養障害を起こしたり、味覚が悪いため遵守することが難しいなどの問題点が指摘されている。経口リン酸吸着剤としては代表的なものとしてカルシウム製剤やマグネシウム製剤、アルミニウム製剤などがあるが、カルシウム製剤とマグネシウム製剤にはそれぞれ高カルシウム血症と高マグネシウム血症の誘発が、アルミニウム製剤にはアルミニウム骨症、アルミニウム脳症、透析痴呆の誘発が指摘されているなどの問題点があった。また、近年経口リン酸吸着剤として種々の陰イオン交換樹脂が開発されているが、これらの陰イオン交換樹脂は前記化合物群に比べてリン酸吸着能が低いため、リン酸塩吸収を減少させるためには高用量の服用が必要であり、患者へのコンプライアンスは良好であるとは決していえない。

【0004】

現在まで使用されてきた高リン血症治療薬はいずれも上記のような弊害を有するにもかかわらず、これらを解決する高リン血症治療薬はこれまで知られていない。

高リン血症治療薬は、例えば、WO 98/03185号公報（特許文献1）や腎と骨代謝Vol. 15, No. 1pp75-80(2002)（非特許文献1）に開示されている。

【0005】

【特許文献1】

WO 98/03185号公報

【非特許文献1】

腎と骨代謝Vol. 15, No. 1pp75-80(2002)

【0006】

【発明の概要】

本発明者らは今般、ウサギ小腸上皮細胞刷子縁膜小胞（以下「ウサギBBMV」という）内へのナトリウム依存性リン酸輸送を阻害し、腎臓および小腸に存在するナトリウム依存性リン酸吸収担体（NaPi-2aおよびNaPi-2b）を細胞膜に発現するアフリカツメガエル卵母細胞内へのナトリウム依存性のリン酸の取り込みを阻害する化合物を見出した。本発明者等はまた、ヒドラジン骨格を有する化合物が放射性同位体元素である ^{32}P を含有する食餌を経口投与された正常ラットの血中放射活性を低下させたことを見出した。

【0007】

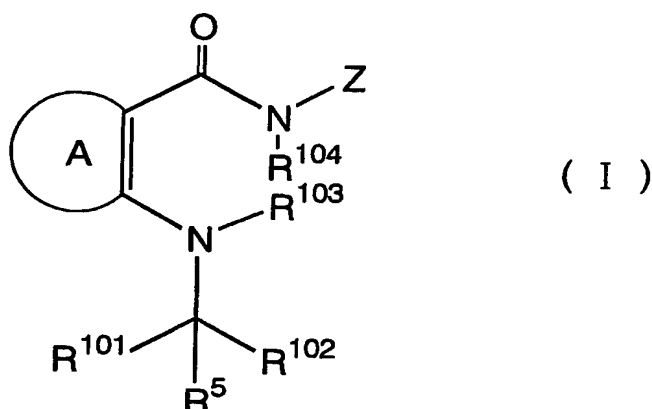
本発明は、従来と異なる機構により血清中のリン濃度を効果的に抑制することにより、血清中のリン酸濃度の上昇により生ずる疾患を効果的に予防または治療できる化合物および医薬組成物の提供をその目的とする。

【0008】

本発明による化合物は、式（I）の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物である。

【0009】

【化1】



(上記式中、

Aは、5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分を表し、この炭素環部分および複素環部分は

- (a)ハロゲン原子；
- (b)水酸基；
- (c)C₁－6アルキル基；
- (d)C₁－6アルコキシ基；
- (e)アリール基；
- (f)アリールオキシ基；
- (g)アリールチオ基；
- (h)アルキルチオ基；
- (i)ニトロ基；または
- (j)アミノ基

により置換されていてもよく、

(c)C₁－6アルキル基、(d)C₁－6アルコキシ基、(e)アリール基、(f)アリールオキシ基、(g)アリールチオ基、および(h)アルキルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁－6アルコキシ基、(5)C₁－6アルキルチオ基、(6)C₁－6アルキルスルフォニル基、(7)モノーまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）

、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更にC₁—6アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、C₁—6アルキル基、C₁—6アルコキシ基、またはC₁—6アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよく、

この炭素環部分および複素環部分が2つの(c)C₁—6アルキル基により置換されている場合には、これらのアルキル基は一緒になってC₃—5アルキレン鎖を形成してもよく、

R⁵は、C₁—6アルキル基、アリール基、C₁—6アルコキシ基、アリールオキシ基、C₁—6アルキルアミノ基、アリールアミノ基、C₁—6アルキルチオ基、アリールチオ基、C₃—7シクロアルキル基、または複素環式基を表し、R⁵が表すC₁—6アルキル基、アリール基、C₁—6アルコキシ基、アリールオキシ基、C₁—6アルキルアミノ基、アリールアミノ基、C₁—6アルキルチオ基、アリールチオ基、C₃—7シクロアルキル基、または複素環式基は、同一または異なってもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁—6アルコキシ基、(5)C₁—6アルキルチオ基、(6)C₁—6アルキルスルフィニル基、(7)C₁—6アルキルスルホニル基、(8)モノーまたはジーC₁—6アルキルアミノ基、(8')複素環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更にC₁—6アルキル基により置換されていてもよい）、(9)C₁—6アルキルカルボニルオキシ基、(10)C₁—6アルキルカルボニルチオ基、(11)C₁—6アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)C₁—6アルキル—またはアリール—スルホニルアミノ基、(18)C₁—6アルキル—またはアリール—ウレイド基、(19)C₁—6アルコキシ—またはアリールオキシ—カルボニルアミノ基、(20)C₁—6アルキルアミノ—またはアリールアミノ—カルボニルオキシ基、(21)カルボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')H

e t-S (=O) j- (H e tは複素環式基を表し、jは0、1、または2を表し、H e tはモノーまたはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよいC₁-6アルキル基

(ここで、(4)C₁-6アルコキシ基、(5)C₁-6アルキルチオ基、(6)C₁-6アルキルスルフィニル基、および(7)C₁-6アルキルスルホニル基のアルキル部分は、ハロゲン原子、C₁-6アルキル基、C₁-6アルコキシ基、C₁-6アルキルチオ基、モノーまたはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシル基、-S (=O)₂ (-OH)、C₁-6アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、C₁-6アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基 (この複素環式基はモノーまたはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ-C₁-6アルキルアミノ基において、ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよいC₁-6アルキル；C₁-6アルコキシ基；C₁-6アルキルチオ基；モノーまたはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (アミノ基上の1または2つのアルキル基は、水酸基により置換されていてもよい) ；アリールアミノ基 (アミノ基は更にC₁-

6 アルキル基により置換されていてもよい) ; モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基; アリールチオ基; 酸素原子; 水酸基; カルボキシ基; C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基; C_{1-6} アルキルカルボニル基; アリール基 (このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基により更に置換されていてもよい) ;

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基;

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキルチオ基;

(V) C_{3-7} シクロアルキル基;

(VI) アリール基;

(VII) アリールオキシ基;

(VIII) C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基;

(VIX) C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基;

(X) 水酸基;

(XI) ニトロ基;

(XII) シアノ基;

(XIII) アミノ基;

(XIV) モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) ;

(XV) アリールアミノ基;

(XVI) C_{1-6} アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基;

(XVII) C_{1-6} アルキル-またはアリール-ウレイド基;

(XVIII) C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基;

(XIX) C_{1-6} アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基;

;

(XX) C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基;

(XXI) アシル基;

(XXII) カルボキシル基;

(XXIII) カルバモイル基;

(XXIV) モノ-またはジ-アルキルカルバモイル基;

(XXV) 複素環式基;

(XXVI) アルキル-またはアリール-スルホニル基;

(XXVII) C₂ - 6 アルケニルオキシ基; または

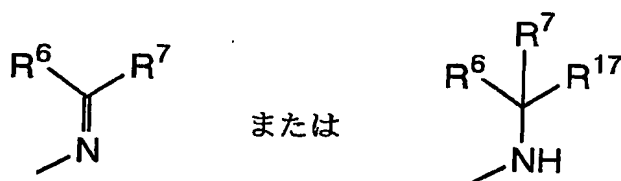
(XXVIII) C₂ - 6 アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

【0010】

Zは

【化2】



を表し、

ここで、R⁶ および R⁷ は、同一または異なってもよく、水素原子、C₁ - 6 アルキル基、C₂ - 6 アルケニル基、C₂ - 6 アルキニル基、アリール基、アリールC₁ - 6 アルキル基、アリールC₂ - 6 アルケニル基、または複素環式基を表し、C₁ - 6 アルキル基、アリール基、アリールC₁ - 6 アルキル基、アリールC₂ - 6 アルケニル基、および複素環式基は、同一または異なってもよく、下記基:

(I) ハロゲン原子;

(II) (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4) C₁ - 6 アルコキシ基、(5) 水酸基により置換されていてもよい C₁ - 6 アルキルチオ基、(6) C₁ - 6 アルキルスルフィニル基、(7) C₁ - 6 アルキルスルホニル基、(8) モノ-または

ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよい)、(9) C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、(10) C_{1-6} アルキルカルボニルチオ基、(11) C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17) C_{1-6} アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18) C_{1-6} アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19) C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20) C_{1-6} アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21)カルボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')Het-S- (Hetは複素環式基を表す)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル基;

(III) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C_{1-6} アルコキシ基、(5)水酸基により置換されていてもよい C_{1-6} アルキルチオ基、(6) C_{1-6} アルキルスルフィニル基、(7) C_{1-6} アルキルスルホニル基、(8)モノ-またはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよい)、(9) C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、(10) C_{1-6} アルキルカルボニルチオ基、(11) C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17) C_{1-6} アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18) C_{1-6} アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19) C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20) C_{1-6} アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21)カルボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')Het-S- (Hetは複素環式基を表す)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい C_{1-6} アルコキシ基;

(IV)ハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキルチオ基;

(V) C_{3-7} シクロアルキル基;

- (VI) アリール基;
 - (VII) アリールオキシ基;
 - (VIII) C₁ - 6 アルキルカルボニルアミノ基;
 - (IX) C₁ - 6 アルキルカルボニルオキシ基;
 - (X) 水酸基;
 - (XI) ニトロ基;
 - (XII) シアノ基;
 - (XIII) アミノ基;
 - (XIV) モノーまたはジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) ;
 - (XV) アリールアミノ基;
 - (XVI) C₁ - 6 アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基;
 - (XVII) C₁ - 6 アルキル-またはアリール-ウレイド基;
 - (XVIII) C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基;
 - (XIX) C₁ - 6 アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基;
 - (XX) C₁ - 6 アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基;
 - (XXI) アシル基;
 - (XXII) カルボキシル基;
 - (XXIII) カルバモイル基;
 - (XXIV) モノーまたはジ-アルキルカルバモイル基;
 - (XXV) 複素環式基;
 - (XXVI) アルキル-またはアリール-スルホニル基; または
 - (XXVII) C₂ - 6 アルケニルオキシ基; または
 - (XXVIII) C₂ - 6 アルキニルオキシ基
- により置換されていてもよく、
R₁₇ は水素原子を表し、
R₁₀₁ と R₁₀₂ が一緒になって=Oを表し、かつ R₁₀₃ および R₁₀₄

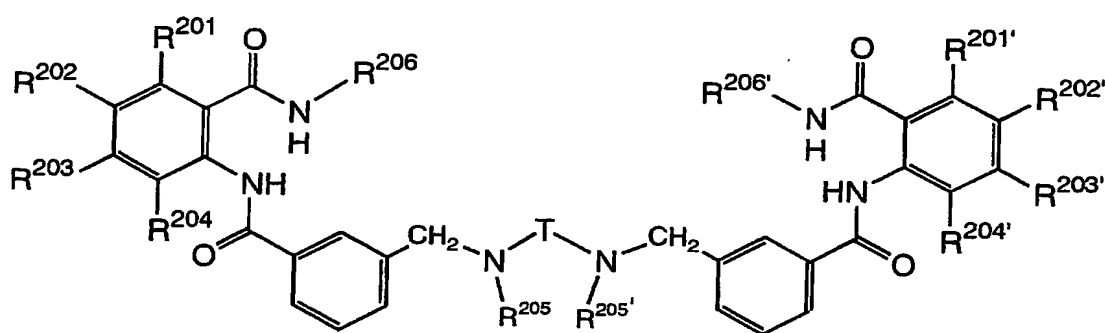
が水素原子を表すか、あるいは

R101とR104が一緒になって結合を表し、かつR102とR103とが一緒になって結合を表す。)

【0011】

本発明による化合物はまた、式(I-3)の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物である。

【化13】



(I-3)

(上記式中、R²⁰¹、R²⁰²、R²⁰³、R²⁰⁴、R^{201'}、R^{202'}、R^{203'}、およびR^{204'}は、同一または異なってもよく、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、C₁-6アルキル基、またはC₁-6アルコキシ基を表し、

R²⁰⁵およびR^{205'}は、同一または異なってもよく、水素原子またはC₁-6アルキル基を表し、

【0012】

R²⁰⁶およびR^{206'}は、同一または異なってもよく、

【化2】



、(上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 がアリール基または飽和または不飽和の5または6員複素環式基(アリール基および複素環式基はハロゲン原子またはハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を表す)

を表し、

Tは C_{2-8} アルキレン鎖を表す)

本発明による医薬組成物は本発明による化合物を含んでなるもの、である。

【0013】

本発明による医薬組成物は、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療に用いることができる。本発明による化合物はまた、血清リン濃度低下剤およびリン酸輸送阻害剤として用いることができる。

【0014】

本発明によれば、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療用医薬の製造のための、本発明による化合物の使用が提供される。

【0015】

本発明によれば、血清リン濃度低下剤の製造のための、本発明による化合物の使用が提供される。

【0016】

本発明によれば、リン酸輸送阻害剤の製造のための、本発明による化合物の使用が提供される。

【0017】

本発明によれば、本発明による化合物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与することを含んでなる、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療方法が提供される。

【0018】

本発明によれば、本発明による化合物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、血流中の血清リン濃度を低下させる方法が提供される。

【0019】

本発明によれば、本発明による化合物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、生体内におけるリン酸輸送を阻害する方法が提供される。

【0020】

【発明の具体的説明】

化合物

本明細書において、基または基の一部としての「C₁—6 アルキル」および「C₁—6 アルコキシ」という語は、基が直鎖または分岐鎖の炭素数 1～6 のアルキル基およびアルコキシ基を意味する。「C₁—6 アルキル」および「C₁—6 アルコキシ」は、好ましくは、C₁—4 アルキルおよび C₁—4 アルコキシであることができる。

【0021】

本明細書において、基または基の一部としての「C₃—7 シクロアルキル」という語は、基が環状の炭素数 3～7 のアルキル基を意味する。「C₃—7 シクロアルキル」は、好ましくは、C₅—7 シクロアルキルであることができる。

【0022】

本明細書において、基または基の一部としての「C₂—6 アルケニル」および「C₂—6 アルキニル」という語は、基が直鎖または分岐鎖の炭素数 2～6 のアルケニル基および炭素数 2～6 のアルキニル基を意味する。「C₂—6 アルケニル」は、好ましくは、C₂—4 アルケニルであることができる。「C₂—6 アルキニル」は、好ましくは、C₂—4 アルキニルであることができる。

【0023】

C₁－6 アルキルの例としては、メチル、エチル、n－プロピル、イソプロピル、n－ブチル、i－ブチル、s－ブチル、t－ブチル、n－ペンチル、n－ヘキシルが挙げられる。

【0024】

C₁－6 アルコキシの例としては、メトキシ、エトキシ、n－プロポキシ、i－プロポキシ、n－ブトキシ、i－ブトキシ、s－ブトキシ、t－ブトキシが挙げられる。

【0025】

C₃－7 シクロアルキルの例としては、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。

【0026】

C₂－6 アルケニルの例としては、アリル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル基が挙げられる。

【0027】

C₂－6 アルキニルの例としては、2－プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基、ヘキシニル基が挙げられる。

【0028】

本明細書において、「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、およびヨウ素原子を意味する。

【0029】

本明細書において、「不飽和の炭素環」および「不飽和の複素環」とは、二重結合等の不飽和結合を1以上有する炭素環および複素環を意味する。

【0030】

本明細書において、「アリール基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基を意味する。アリール基の例としては、フェニル基、ナフチル基、アントリル基が挙げられる。

【0031】

本明細書において、「アリールC₁－6 アルキル基」とは、単環性、二環性、

または三環性の芳香族炭化水素基により置換された C_{1-6} アルキル基を意味する。アリール C_{1-6} アルキル基の例としては、ベンジル基 ($C_6H_5CH_2-$)、フェネチル基 ($C_6H_5CH_2CH_2-$) が挙げられる。

【0032】

本明細書において、「アリールアミノ基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基により置換されたアミノ基を意味する。

【0033】

本明細書において、「アリール C_{2-6} アルケニル基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基により置換された C_{2-6} アルケニル基を意味する。アリール C_{2-6} アルケニル基の例としては、フェニルエテニル基 ($C_6H_5-CH=CH-$) が挙げられる。

【0034】

本明細書において、「複素環式基」とは、飽和または不飽和の 5～9 員（好ましくは 5～7 員、より好ましくは 5 または 6 員）の単環性複素環式基および飽和または不飽和の 9～11 員二環性複素環式基を意味する。複素環式基は、酸素原子、窒素原子、および硫黄原子から選択される異種原子を一個以上含む。複素環の例としては、ピリジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピリダジル、ピリミジル、ピラジル、およびイソキサゾリルが挙げられる。

【0035】

本明細書において、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は、窒素原子に結合する二つの C_{1-6} アルキル基が一緒になって「環状アミノ基」を形成してもよい。「環状アミノ基」とは、窒素原子に結合する二つの C_{1-6} アルキル基が一緒になって形成された複素環式基を意味する。環状アミノ基は、アミノ基の窒素原子以外に 1～3 個の異種原子（好ましくは、1 個の酸素原子または 1 個の窒素原子）を含んでいてもよい。環状アミノ基の例としては、ピペリジル基、ピペラジル基、およびモルホリル基が挙げられる。

【0036】

式 (I) にはヒドラジン誘導体とキナゾロン誘導体が含まれている。 R_{101} と R_{102} が一緒になって $=O$ を表し、かつ R_{103} および R_{104} が水素原子

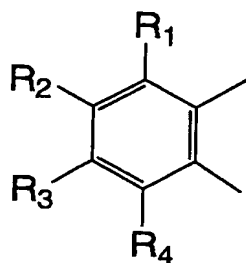
を表す場合には式 (I) はヒドラジン誘導体を表し、R 1 0 1 と R 1 0 4 が一緒になって結合を表し、かつ R 1 0 2 と R 1 0 3 とが一緒になって結合を表す場合には式 (I) はキナゾロン誘導体を表す。

【0037】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、A が表す 5～9 員の不飽和の炭素環部分または 5～9 員の不飽和の複素環部分は、例えば、ベンゼン環部分およびシクロヘキセン環部分を表すことができ、より好ましくは、式 (IIa) を表すことができる。

【0038】

【化3】



(IIa)

(上記式中、R 1、R 2、R 3、および R 4 は、同一または異なっているとしてもよく、

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c) C 1 - 6 アルキル基；
- (d) C 1 - 6 アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；または
- (k) 水素原子

を表し、

(c) C_{1-6} アルキル基、(d) C_{1-6} アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および(h) アルキルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C_{1-6} アルコキシ基、(5) C_{1-6} アルキルチオ基、(6) C_{1-6} アルキルスルフォニル基、(7)モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基 (このアミノ基は更に C_{1-6} アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、または C_{1-6} アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい)

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) においてAが式 (II a) を表す場合には、好ましくは、 R^1 、 R^3 、および R^4 は、同一または異なっているとしてもよく、

水素原子；

ハロゲン原子；

C_{1-6} アルキル基 (このアルキル基は、 C_{1-6} アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；

アリール基 (このアリール基は、 C_{1-6} アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；

C_{1-6} アルコキシ基 (このアルコキシ基は、 C_{1-6} アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；または

アリールオキシ基 (このアリールオキシ基は、 C_{1-6} アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表し、

R^2 は

水素原子；

ハロゲン原子；

水酸基；

C₁ - 6 アルキル基 (このアルキル基は、(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、(5)C₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフォニル基、(7)モノまたはジC₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ-C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基 (このアミノ基は更にC₁ - 6 アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、C₁ - 6 アルキル基、C₁ - 6 アルコキシ基、またはC₁ - 6 アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) ; または

C₁ - 6 アルコキシ基 (このアルコキシ基は、(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、(5)C₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフォニル基、(7)モノまたはジC₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ-C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表すことができ、より好ましくは、

R¹、R³、およびR⁴ は水素原子を表し、

R² は

ハロゲン原子；

水酸基；

モノまたはジC₁ - 6 アルキルアミノ基により置換されていてもよいC₁ - 6 アルキル基；または

モノまたはジC₁ - 6 アルキルアミノ基により置換されていてもよいC₁ - 6 アルコキシ基

を表す。

【0039】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (II a) を表す場合には、 R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 は、好ましくは、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい C_{1-6} アルキル基；置換基を有してもよい C_{1-6} アルコキシ基を表すことができる。

【0040】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (II a) を表す場合には、 R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 は、より好ましくは、水素原子を表すことができる。

【0041】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (II a) を表す場合には、より好ましくは、 R^1 および R^4 が水素原子を表し、 R^2 および R^3 のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい C_{1-6} アルキル基；置換基を有してもよい C_{1-6} アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表すことができる。

【0042】

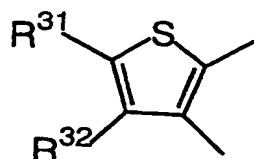
式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (II a) を表す場合には、より好ましくは、 R^1 および R^4 が水素原子を表し、 R^2 および R^3 が、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい C_{1-6} アルキル基；置換基を有してもよい C_{1-6} アルコキシ基を表すことができる。

【0043】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、A が表す 5～9 員の不飽和の炭素環部分または 5～9 員の不飽和の複素環部分は、好ましくは、式 (II b) を表す。

【0044】

【化 4】



(IIb)

(上記式中、 R^{31} および R^{32} は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；または C_{1-6} アルキル基（このアルキル基は(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C_{1-6} アルコキシ基、(5) C_{1-6} アルキルチオ基、(6) C_{1-6} アルキルスルフォニル基、(7)モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基（ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更に C_{1-6} アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、または C_{1-6} アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい）を表し、 R^{31} と R^{32} とは一緒になって C_{3-5} アルキレン鎖を形成してもよい）

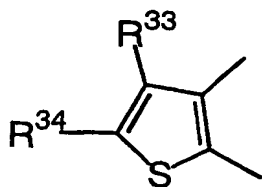
式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(IIb)を表す場合には、 R^{31} および R^{32} は、好ましくは、両方が水素原子を表すか、または R^{31} および R^{32} のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を表し、あるいは R^{31} と R^{32} とが一緒になって C_{3-5} アルキレン鎖を形成する。

【0045】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において、Aが表す5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分は、好ましくは、式(IIc)を表す。

【0046】

【化5】



(IIc)

(上記式中、 R^{33} および R^{34} は、同一または異なっているもよく、水素原子；ハロゲン原子；または C_{1-6} アルキル基（このアルキル基は(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) C_{1-6} アルコキシ基、(5) C_{1-6} アルキルチオ基、(6) C_{1-6} アルキルスルフォニル基、(7)モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基（ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルフォニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更に C_{1-6} アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、または C_{1-6} アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい）を表し、 R^{33} と R^{34} とは一緒になって C_{3-5} アルキレン鎖を形成してもよい）

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) においてAが式 (IIc) を表す場合には、 R^{33} および R^{34} は、好ましくは、両方が水素原子を表すか、または R^{33} および R^{34} のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を表し、あるいは R^{33} と R^{34} とが一緒になって C_{3-5} アルキレン鎖を形成する。

【0047】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、 R^5 は好ましくは、置換基を有してもよい C_{5-7} シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（より好ましくは、フェニル基またはナフチル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（より好まし

くは、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基)を表すことができる。

【0048】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、R⁵は、特に好ましくは、C₅-7シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、およびピリミジル基から選択される環状基 (この環状基は、ハロゲン原子; ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁-6アルキル基; ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁-6アルコキシ基; または水酸基により置換されていてもよい) を表す。

【0049】

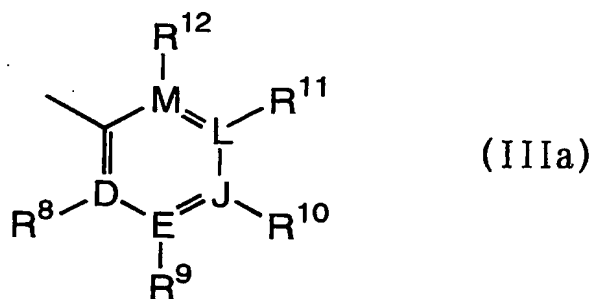
式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、R⁵は、特に好ましくは、C₅-7シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、およびピリミジル基から選択される環状基 (この環状基は、C₁-6アルキルにより置換されていてもよく、このアルキル基は、置換されていてもよいC₁-6アルコキシ基、置換されていてもよいC₁-6アルキルチオ基、置換されていてもよいC₁-6アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいC₁-6アルキルスルホニル基、または置換されていてもよいモノ-またはジ-C₁-6アルキルアミノ基 (ジ-C₁-6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) により更に置換されていてもよい) を表す。

【0050】

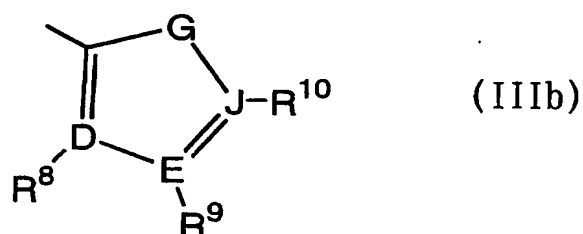
式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、R⁵は、好ましくは、式 (IIIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表す。

【0051】

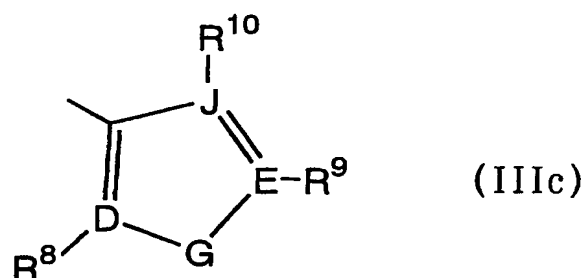
【化 6】



【化 7】



【化 8】



(上記式中、

D、E、J、L、およびMは、同一または異なってもよく、炭素原子または窒素原子を表し、

Gは酸素原子または硫黄原子を表し、

R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²は、同一または異なってもよく、

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C₁ - 6 アルコキシ基、
(5)C₁ - 6 アルキルチオ基、(6)C₁ - 6 アルキルスルフィニル基、(7)C₁ -

6 アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基、(8') 複素環式基により置換されたアミノ基 (この複素環式基は更に C_{1-6} アルキル基により置換されていてもよい)、(9) C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、(10) C_{1-6} アルキルカルボニルチオ基、(11) C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17) C_{1-6} アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18) C_{1-6} アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19) C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20) C_{1-6} アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21) カルボキシル基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23') $Het-S(=O)_j-$ (Het は複素環式基を表し、 j は 0、1、または 2 を表し、 Het はモノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24) シアノ基、および(25) ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル基

(ここで、(4) C_{1-6} アルコキシ基、(5) C_{1-6} アルキルチオ基、(6) C_{1-6} アルキルスルフィニル基、および(7) C_{1-6} アルキルスルホニル基のアルキル部分は、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシル基、 $-S(=O)_2(-OH)$ 、 C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基 (この複素環式基はモノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基 (ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく

、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基において、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル； C_{1-6} アルコキシ基； C_{1-6} アルキルチオ基；モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基（アミノ基上の1または2つのアルキル基は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更に C_{1-6} アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルカルバモイルメチル基（ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシル基； C_{1-6} アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； C_{1-6} アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい）；または複素環式基により更に置換されていてもよい）；

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基；

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキルチオ基；

(V) C_{3-7} シクロアルキル基；

(VI) アリール基；

(VII) アリールオキシ基；

(VIII) C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基；

(VIX) C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基；

(X) 水酸基；

(XI) ニトロ基；

(XII) シアノ基；

(XIII) アミノ基；

(XIV) モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ基（ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；

(XV) アリールアミノ基；

(XVI) C_{1-6} アルキルーまたはアリールスルホニルアミノ基；

(XVII) C_{1-6} アルキルーまたはアリールウレイド基；

(XVIII) C_{1-6} アルコキシーまたはアリールオキシカルボニルアミノ基；

(XIX) C_{1-6} アルキルアミノーまたはアリールアミノカルボニルオキシ基；

(XX) C_{1-6} アルコキシーまたはアリールオキシカルボニル基；

(XXI) アシル基；

(XXII) カルボキシル基；

(XXIII) カルバモイル基；

(XXIV) モノーまたはジアルキルカルバモイル基；

(XXV) 複素環式基；

(XXVI) アルキルーまたはアリールスルホニル基；

(XXVII) C_{2-6} アルケニルオキシ基；

(XXVIII) C_{2-6} アルキニルオキシ基；または

(XXIX) 水素原子

を表し、

D、E、J、L、またはMが窒素原子を表す場合、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} はそれぞれ存在しないか、あるいは窒素原子と一緒になってN-オキシド（ $N \rightarrow O$ ）を形成していてもよい。）

式（I）並びに後記する式（I-1）および式（I-2）において R_5 が式（III a）、式（III b）、および式（III c）を表す場合には、

R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が、好ましくは、同一または異なっているとしてもよく、

水素原子；

ハロゲン原子；
 ヒドロキシメチル基；または
 ハロゲン原子により置換されていてもよい C₁ - 6 アルキル基
 を表す。

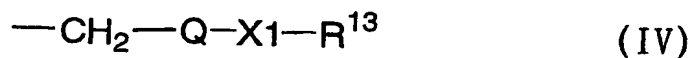
【0052】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において R⁵ が式 (III a)、式 (III b)、および式 (III c) を表す場合には、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、および R¹² が表すことがある置換された C₁ - 6 アルキル基は、好ましくは、

【0053】

式 (IV) の基：

【化9】



(上記式中、

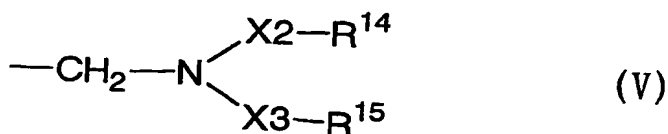
Q は、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、またはスルフォニル基を表し、
 X¹ は結合または炭素数 1 ~ 5 の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、
 R¹³ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - 6 アルキル基、C₁ - 6 アルコキシ基、C₁ - 6 アルキルチオ基、モノーまたはジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい)、アリアルオキシ基、アリアルチオ基、水酸基、カルボキシル基、-S(=O)₂(-OH)、C₁ - 6 アルコキシ-またはアリアルオキシ-カルボニル基、C₁ - 6 アルキルカルボニル基、アリアル基、または複素環式基 (この複素環式基はモノーまたはジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基 (ジ- C₁ - 6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基に

より置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) ;

【0054】

または式 (V) の基

【化10】



(上記式中、

X 2 は結合または炭素数 1 ～ 5 の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、
 X 3 は結合または炭素数 1 ～ 5 の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、
 R¹⁴ および R¹⁵ は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよい C₁—6 アルキル；C₁—6 アルコキシ基；C₁—6 アルキルチオ基；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルアミノ基（アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更に C₁—6 アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ—C₁—6 アルキルカルバモイルメチル基（ジ—C₁—6 アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ～ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシ基；C₁—6 アルコキシ—またはアリールオキシ—カルボニル基；C₁—6 アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい）；または複素環式基を表し、但し、X 2 が結合を表す場合には R¹⁴ は水素原子を表し、X 3 が結合を表す場合には R¹⁵ は水素原子を表し、あるいは

R¹⁴ および R¹⁵ はそれらが結合している窒素原子と一緒になって複素環式

基を形成してもよく、この複素環式基はR¹⁴およびR¹⁵が結合している窒素原子以外に更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、この複素環式基は更に水酸基；水酸基により置換されていてもよいC₁－6アルキル；モノーまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；飽和または不飽和の5または6員複素環式基；モノーまたはジ－C₁－6アルキルカルバモイルメチル基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；フェニル基；または酸素原子により置換されていてもよい。）

を表す。

【0055】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくはD、E、J、L、およびMが炭素原子を表す。

【0056】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す。

【0057】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²のうち一つが水素原子以外の基を表し、残りの基が水素原子を表す。

【0058】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を

表し、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²のうち一つがハロゲン原子；置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基；または置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシ基を表し、残りの基が水素原子を表す。

【0059】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、R¹⁰が水素原子以外の基(好ましくは、置換されたC₁₋₆アルキル基、より好ましくは式(IV)または式(V)の基)を表し、R⁸、R⁹、R¹¹、およびR¹²が水素原子を表す。

【0060】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、R¹¹が水素原子以外の基(好ましくは、置換されたC₁₋₆アルキル基、より好ましくは式(IV)または式(V)の基)を表し、R⁸、R⁹、R¹⁰、およびR¹²が水素原子を表す。

【0061】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、およびR¹²のうち二つが水素原子以外の基を表し、残りの基が水素原子を表す。

【0062】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、LおよびMが炭素原子を表し、R¹⁰およびR¹¹が水素原子以外の基(好ましくは置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシ基、より好ましくは置換されていてもよいメトキシ基)を表し、R⁸、R⁹、およびR¹²が水素原子を表す。

【0063】

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてR⁵が式(IIIa)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を

表し、R⁹ および R¹¹ が水素原子以外の基（好ましくは、置換されていてもよい C₁-6 アルコキシ基、より好ましくは置換されていてもよいメトキシ基）を表し、R⁸、R¹⁰、および R¹² が水素原子を表す。

【0064】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において R⁵ が式 (IIIb) および式 (IIIc) を表す場合には、好ましくは、D、E、および J が炭素原子を表す。

【0065】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において R⁵ が式 (IIIb) および式 (IIIc) を表す場合には、好ましくは、D、E、および J のいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す。

【0066】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、好ましくは、R⁶ は、水素原子；置換基を有してもよい C₁-6 アルキル基；または置換基を有していてもよいアリール基を表す。

【0067】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、R⁶ は、より好ましくは、水素原子；ハロゲン原子または C₁-6 アルコキシ基により置換されていてもよい C₁-6 アルキル基；またはハロゲン原子、C₁-6 アルキル基、または C₁-6 アルコキシ基により置換されていてもよいアリール基を表し、最も好ましくは、水素原子または C₁-6 アルキル基を表すことができる。

【0068】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、好ましくは、R⁷ は、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C₁-6 アルキル基、置換を有していてもよいアリール C₂-6 アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表す。

【0069】

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、R⁷ は、

より好ましくは、フェニル基、ナフチル基、フリル基、ピロリル基、およびチエニル基から選択される環状基（この環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁－6アルキル基；C₁－6アルコキシ基（このアルコキシ基は、ハロゲン原子；アリールオキシ基（このアリールオキシ基はハロゲン原子及びC₁－6アルキル基により置換されてもよい）；C₁－6アルコキシ基（このアルコキシ基は、モノまたはジC₁－6アルキルアミン（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ハロゲン原子により置換されていてもよい）；アリールチオ基（このアリールチオ基はハロゲン原子及びC₁－6アルキル基により置換されていてもよい）；C₁－6アルキルチオ基（このアルキルチオ基は、モノまたはジC₁－6アルキルアミン（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ハロゲン原子により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（このアリールアミノ基はさらにC₁－6アルキルによって置換されていてもよい）；モノまたはジC₁－6アルキルアミン（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）により置換されていてもよい）；水酸基；モノまたはジ－C₁－6アルキルアミノ基（ジ－C₁－6アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ニトロ基；C₂－6アルケニルオキシ基；またはC₂－6アルキニルオキシ基により置換されていてもよい）を表す。

【0070】

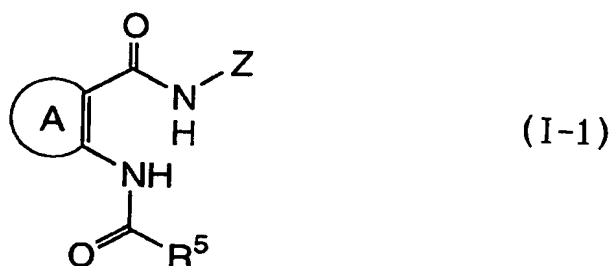
式（I）並びに後記する式（I－1）および式（I－2）において、好ましくは、R⁶は水素原子またはC₁－6アルキル基を表し、R⁷は、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC₁－6アルキル基、置換を有していてもよいアリールC₂－6アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表す。

【0071】

式（I）の化合物のうちヒドラジン誘導体は、式（I－1）で表わすことがで

きる。

【化11】



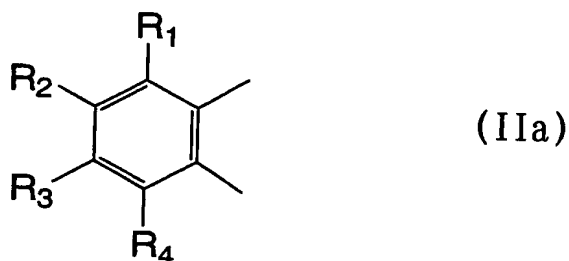
(上記式中、A、R⁵、およびZは式(I)において定義された内容と同義である。)

【0072】

式(I-1)において、好ましくは、

Aが式(IIa)：

【化3】



(上記式中、R¹、R²、R³、およびR⁴は、式(IIa)において定義された内容と同義であり、好ましくは、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有していてもよいC₁－6アルキル基；または置換基を有していてもよいC₁－6アルコキシ基を表す。)

であり、

R⁵が、置換基を有してもよいC₅－7シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（好ましくは、フェニル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基）を表し、より好ましくは、式(

IIIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

【0073】

Zが下記基:

【化2】



(上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C_{1-6} アルキル基、置換を有していてもよいアリール C_{2-6} アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す。

【0074】

式 (I-1) において、好ましくは、

Aが式 (IIb) :

【化4】



(IIb)

(上記式中、 R^{31} および R^{32} は、式 (IIb) において定義された内容と同義であり、好ましくは、 R^{31} および R^{32} が水素原子を表すか、または R^{31} および R^{32} のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を表し、あるいは R^{31} と R^{32} とが一緒になって C_{3-5} アルキレン鎖を形成している。)

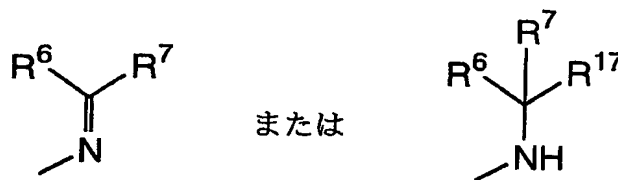
であり、

R⁵が、置換基を有してもよいC₅－7シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（好ましくは、フェニル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基）を表し、より好ましくは、式（IIIa）、式（IIIb）、または式（IIIc）の基を表し、

【0075】

Zが下記基：

【化2】



（上記式中、R⁶が水素原子またはC₁－6アルキル基を表し、R⁷が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC₁－6アルキル基、置換を有していてもよいアリールC₂－6アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、R¹⁷が水素原子を表す）

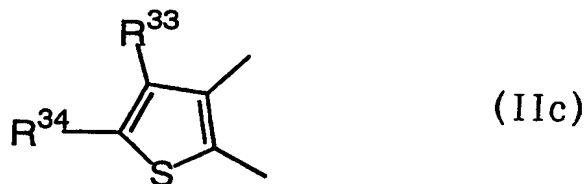
を表す。

【0076】

式（I-1）において、好ましくは、

Aが式（IIc）：

【化5】



(上記式中、 R^{33} および R^{34} は、式(IIc)において定義された内容と同義であり、好ましくは、 R^{33} および R^{34} が水素原子を表すか、または R^{33} および R^{34} のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を表し、あるいは R^{33} と R^{34} とが一緒になって C_{3-5} アルキレン鎖を形成している。)

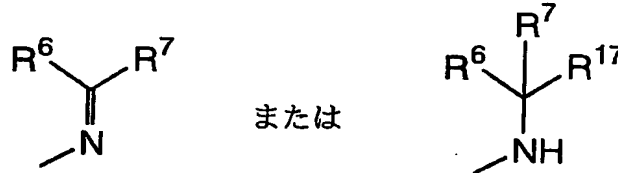
であり、

R^5 が、置換基を有してもよい C_{5-7} シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基(好ましくは、フェニル基)、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基(好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基)を表し、より好ましくは、式(IIIa)、式(IIIb)、または式(IIIc)の基を表し、

【0077】

Zが下記基:

【化2】



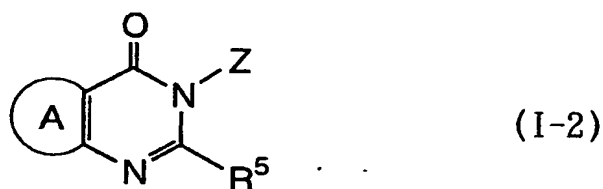
(上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C_{1-6} アルキル基、置換を有していてもよいアリール C_{2-6} アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す)

を表す。

【0078】

式(I)の化合物のうちキナゾロン誘導体は、式(I-2)で表わすことができる。

【化 1 2】



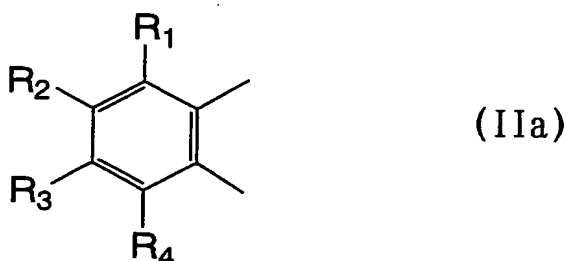
(上記式中、A、R⁵、およびZは式(I)において定義された内容と同義である。)

【0079】

式(I-2)において、好ましくは、

Aが式(IIa) :

【化 3】



(上記式中、R¹、R²、R³、およびR⁴は、式(IIa)において定義された内容と同義であり、好ましくは、同一または異なっていてもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有していてもよいC₁—6アルキル基；または置換基を有していてもよいC₁—6アルコキシ基を表す。)

であり、

R⁵が、置換基を有してもよいC₅—7シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（好ましくは、フェニル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基）を表し、より好ましくは、式(IIIa)、式(IIIb)、または式(IIIc)の基を表し、

【0080】

Zが下記基:

【化2】



(上記式中、R⁶が水素原子またはC₁—6アルキル基を表し、R⁷が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC₁—6アルキル基、置換を有していてもよいアリールC₂—6アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、R¹⁷が水素原子を表す)

を表す。

【0081】

式(I-2)において、好ましくは、

Aが式(IIb):

【化4】



(上記式中、R³¹およびR³²は、式(IIb)において定義された内容と同義であり、好ましくは、R³¹およびR³²が水素原子を表すか、またはR³¹およびR³²のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよいC₁—6アルキル基を表し、あるいはR³¹とR³²とが一緒になってC₃—5アルキレン鎖を形成している。)

であり、

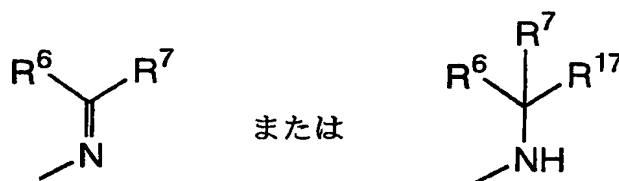
R⁵が、置換基を有してもよいC₅—7シクロアルキル基、置換基を有しても

よいアリール基（好ましくは、フェニル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基（好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基）を表し、より好ましくは、式（IIIa）、式（IIIb）、または式（IIIc）の基を表し、

【0082】

Z が下記基：

【化 2】



（上記式中、 R^6 が水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、 R^7 が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C_{1-6} アルキル基、置換を有していてもよいアリール C_{2-6} アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 R^{17} が水素原子を表す）

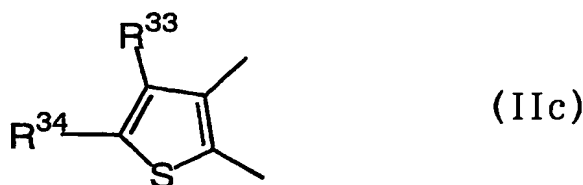
を表す。

【0083】

式（I-2）において、好ましくは、

A が式（IIc）：

【化 5】



(IIc)

（上記式中、 R^{33} および R^{34} は、式（IIc）において定義された内容と同義であり、好ましくは、 R^{33} および R^{34} が水素原子を表すか、または R^{33} お

よび R³⁴ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい C₁ - 6 アルキル基を表し、あるいは R³³ と R³⁴ とが一緒になって C₃ - 5 アルキレン鎖を形成している)

であり、

R⁵ が、置換基を有してもよい C₅ - 7 シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (IIIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

【0084】

Z が下記基:

【化 2】



(上記式中、R⁶ が水素原子または C₁ - 6 アルキル基を表し、R⁷ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール C₁ - 6 アルキル基、置換を有していてもよいアリール C₂ - 6 アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、R¹⁷ が水素原子を表す)

を表す。

【0085】

本発明による化合物の好ましい例としては、実施例に記載の化合物 1 ~ 785 が挙げられる。

【0086】

本発明による化合物はその薬学上許容される塩とすることができる。好ましい例としては、ナトリウム塩、カリウム塩またはカルシウム塩のようなアルカリ金

属またはアルカリ土類金属塩；フッ化水素酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩；硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、リン酸塩などの無機酸塩；メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような低級アルキルスルホン酸塩；ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩のようなアリールスルホン酸塩；フマル酸、コハク酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩、酢酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩、アスコルビン酸塩のような有機酸塩；およびグリシン酸塩、フェニルアラニン酸塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩などが挙げられる。

【0087】

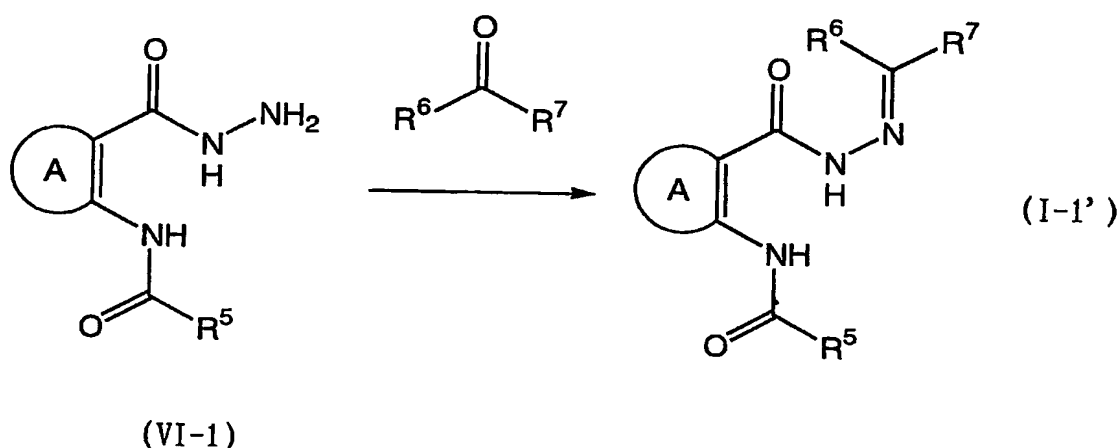
化合物の製造

式(I)の化合物は、式(VI-1)または(VI-2)のヒドラジン化合物を適当な溶媒(例えば、トルエン)中、適当な酸触媒(例えば、酢酸)の存在下で適当なカルボニル化合物(化合物C)を作用させることにより製造することができる。

【0088】

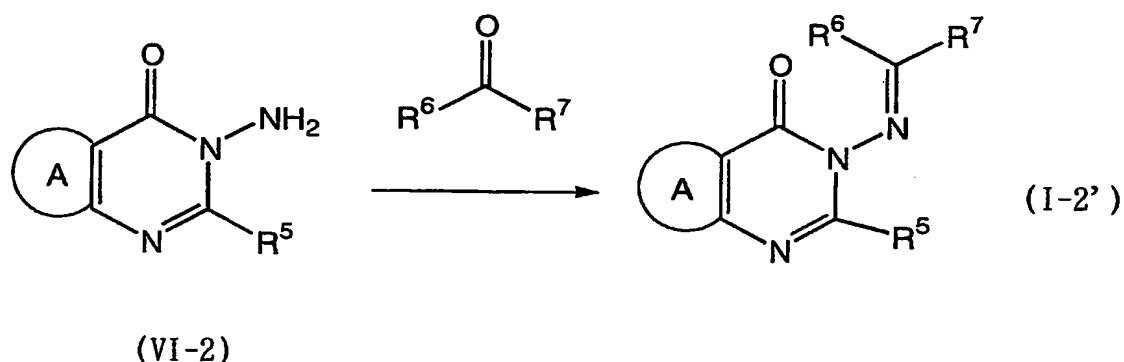
スキーム1

【化14】



【0089】

【化15】



(上記スキーム中、A、R⁵、R⁶、およびR⁷は式(I)において定義された内容と同義である。)

式(VI-1)および式(VI-2)の化合物は、市販されているものを使用することができる。

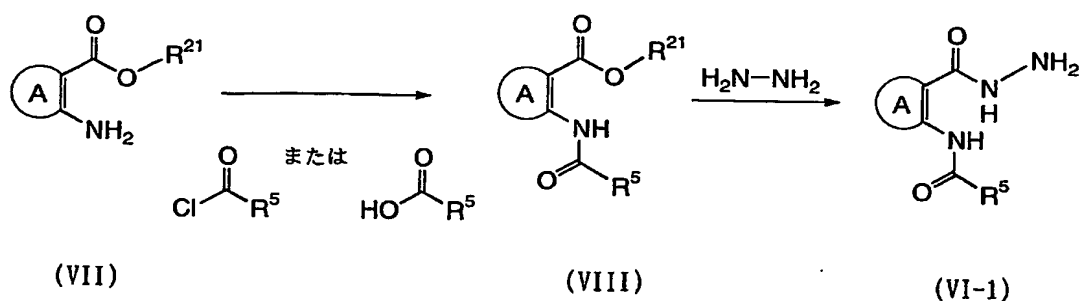
【0090】

式(VI-1)および式(VI-2)の化合物はまた、式(VII)のアミノ化合物(化合物A)に適切な酸クロライド(化合物B)を作用させるか、あるいは適当なカルボン酸(化合物B)を適当な縮合剤(例えば、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド ハイドロクロライド)の存在下で作用させることにより式(VIII)のアミド化合物を製造し、次いで式(VIII)のアミド化合物を適当な溶媒(例えばエタノール)中で、ヒドラジンを添加し、加熱することにより製造することができる。ヒドラジン化反応における反応温度を高温にし、かつ反応時間を増加させることにより、式(VI-2)の還元体を製造することができる。例えば、30~40℃、12~24時間の反応条件で式(VI-1)の化合物を、110~120℃、72~96時間の反応条件で式(VI-2)の化合物を製造することができる。

【0091】

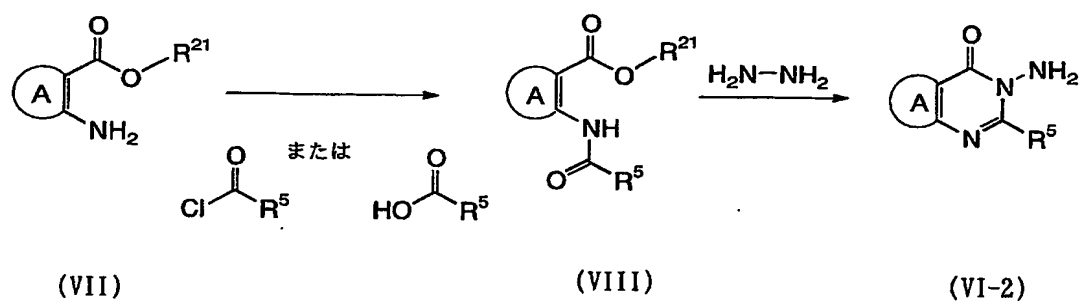
スキーム2

【化 16】



【0092】

【化 17】



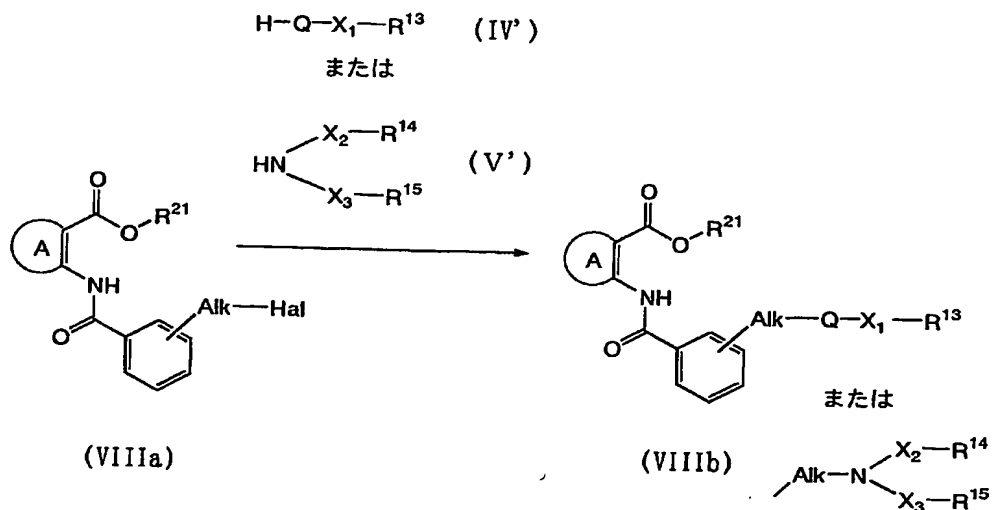
(上記スキーム中、AおよびR⁵は式(I)において定義された内容と同義であり、R²¹は水素原子またはカルボキシル基の保護基を表す。)

R⁵が式(IV)または式(V)により置換されたフェニル基である化合物は、式(VIIIa)の化合物に式(IV')または式(V')の化合物(化合物B')を作用させることにより式(VIIIb)の化合物を得、次いで式(VIIIb)の化合物をスキーム1および2の反応に付すことによって得ることができる。

【0093】

スキーム3

【化18】



(上記スキーム中、AおよびR⁵は式(I)において定義された内容と同義であり、Q、X₁、およびR¹³は式(IV)において定義された内容と同義であり、X₂、X₃、R¹⁴およびR¹⁵は式(V)において定義された内容と同義であり、R²¹は水素原子またはカルボキシル基の保護基を表し、Alkは炭素数1～6のアルキレン鎖を表し、Halはハロゲン原子を表す。)

【0094】

式(I-3)のタンデム型の化合物もスキーム3に従って製造できる。具体的には、式(VIIIa)の化合物に、式(IV')および式(V')の化合物に代えて、H-NR²⁰⁵-T-NR^{205'}-H(R²⁰⁵、R^{205'}、およびTは式(I-3)において定義された内容と同義である。)を反応させることにより、式(VIIIa)の化合物がタンデムに結合した化合物を得ることができる。この化合物をスキーム1および2の反応付すことにより式(I-3)の化合物を得ることができる。

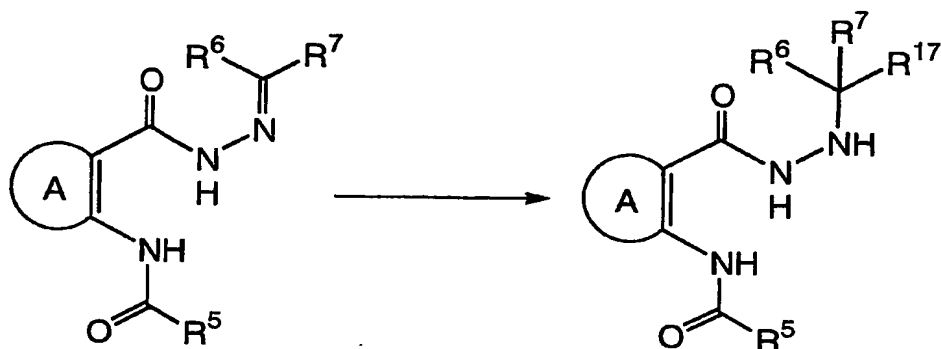
【0095】

式(I)においてZが-NH-CR⁶R⁷R¹⁷であるイミン還元体は、スキーム1で製造された化合物を適当な溶媒(例えば、メタノール)に溶解させ、適当な還元剤(例えば、水素化ホウ素ナトリウム)を用いて還元することにより、製造することができる。

【0096】

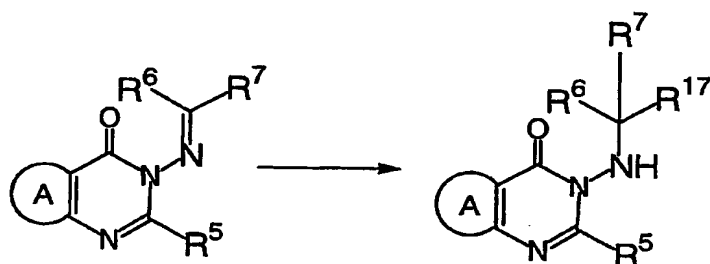
スキーム 4

【化19】



【0097】

【化20】



(上記スキーム中、A、R⁵、R⁶、R⁷、およびR¹⁷は式(I)において定義された内容と同義である。)

【0098】

化合物の用途

生体内におけるリンの恒常性維持は、細胞に存在するナトリウム依存性リン酸輸送担体 (NaPi: sodium dependent phosphate transporter) 群によって担われていることが知られている。特に、通常血清リン濃度は腸管上皮細胞でのリン酸の吸収と腎臓尿細管細胞でのリン酸の再吸収によって調節されており、これらの機構にも前述のリン酸輸送担体が関与している。

【0099】

本発明による化合物は、主に腸管からのリン酸吸収や腎臓からのリン酸再吸収

を規定するこれらのリン酸トランスポーターを阻害することができる（薬理試験例 1～3 参照）。

【0100】

本発明による化合物はまた、ラットの腸管においてリン吸収阻害活性を示す（薬理試験例 4 参照）。

【0101】

従って、本発明による化合物は、血清リン低下作用が治療上有効である疾患の予防または治療に用いることができる。

【0102】

本明細書において、「血清リン低下作用」とは、血清のリン酸濃度を低下させる作用を意味する。血清中のリン酸濃度は、（i）腸管からの吸収と尿および糞への排泄、並びに（ii）体内における細胞や骨組織に代表される石灰化組織との出納で規定される。本明細書において「血清リン低下作用」は、健全な生体に対して作用させた場合において血清中リン酸濃度を低下させる作用も含んでおり、必ずしも高リン血症における血清中リン酸濃度を低下させる作用のみを意味するものではない。

【0103】

本発明による化合物はまた、リン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療に用いることができる。

【0104】

本明細書において、「リン酸輸送の阻害」とは、対象細胞の細胞膜に存在するリン酸輸送担体の輸送活性を阻害することを意味する。対象細胞としては小腸上皮細胞、腎臓上皮細胞、肺上皮細胞、血管内皮細胞、血管平滑筋細胞または骨芽細胞などが挙げられる。

【0105】

血清リン低下作用が治療上有効である疾患およびリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患としては（1）高リン血症、（2）腎不全および慢性腎不全、（3）二次性副甲状腺機能亢進症およびこれに関連する疾患、（4）代謝性骨疾患、（5）カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患、および

(6) その他の高リン血症に関連する疾患が挙げられる。

【0106】

(1) 高リン血症

本発明による化合物は血清中のリン酸濃度を低下させ、リン酸輸送を阻害することができることから、高リン血症の予防または治療に用いることができる。本明細書において「高リン血症」とは血清リン濃度が臨床上定義されている正常域を逸脱している状態を意味する。

【0107】

(2) 腎不全および慢性腎不全

腎不全および慢性腎不全に関しては、血清リン濃度の上昇そのものが腎不全の増悪因子であることが近年示唆されている。事実、慢性腎不全患者へのリン酸の摂取制限により腎不全の進行を遅らせることができるという報告も相次いでいる (Maschio et al., Kidney Int., 22:371-376, 1982, Maschio et al., Kidney Int., 24:S273-277, 1983, Barsotti et al., Kidney Int. 24:S278-284, 1983)。

よって、リン酸輸送を阻害し、血清中のリン酸濃度を低下させることができる本発明による化合物は、腎不全および慢性腎不全の予防および治療に用いることができる。

【0108】

(3) 二次性副甲状腺機能亢進症および原発性副甲状腺機能亢進症並びにこれらに関連する疾患

高リン血症は二次的に低カルシウム血症を招くため二次的な副甲状腺機能亢進症を誘発することが知られている。従って、本発明による化合物は二次性副甲状腺機能亢進症の予防および治療に用いることができる。

【0109】

さらに最近ではリン濃度の上昇が副甲状腺細胞からの PTH (parathyroid hormone; 副甲状腺ホルモン) の分泌を促進するとの報告 (Almanden Y et al., J Bone Miner Res 11:970-976, 1996) や、リン制限によりその分泌が抑制されるとの報告 (Rachel K et al., J Clin Invest 96:327-333, 1995)、副甲状腺の過形成が抑制されるとの報告 (Slatopolsky E et al., J Clin Invest 97:2534-2540, 1

996) などもある。血清リン濃度自体が副甲状腺の過形成やPTH分泌に関与することを示唆するこれらの報告を踏まえると、本発明による化合物は血清リン濃度を低下させることにより二次性副甲状腺機能亢進症のみならず原発性副甲状腺機能亢進症の予防および治療に用いることができる。本発明による化合物は更に、二次性副甲状腺機能亢進症によって誘導される腎性骨栄養症、すなわち、線維性骨炎、骨・関節痛、骨変形、骨折などの予防および治療に用いることもできる。

【0110】

本発明による化合物は二次性副甲状腺機能亢進症を予防および治療することができることから、二次性副甲状腺機能亢進症におけるPTH増加により生ずるといわれている中枢・末梢神経障害、貧血、心筋障害、高脂血症、糖代謝異常、皮膚掻痒、腱断裂、性機能異常、筋肉障害、皮膚虚血性潰瘍、成長遅延、心伝導障害、肺拡散障害、免疫不全、骨・関節痛、骨変形、骨折等の予防および治療にも用いることができる。

【0111】

(4) カルシウム・リン代謝異常疾患

本発明による化合物はリン代謝異常病態を是正できるに留まらず、カルシウムを含めたミネラル代謝異常病態に対しても改善作用を有すると考えられる。従って本発明による化合物は代謝性骨疾患のようなカルシウム・リン代謝異常疾患の予防および治療に用いることができる。

【0112】

(5) カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患

透析患者においては、多量のカルシウム製剤の投与やビタミンD投与、タンパクの過剰摂取による血清リン濃度の管理不良といった状態が発生すると、血中のカルシウム・リン積の上昇により異所性石灰化が生じやすくなり、ひいては冠動脈をはじめとした血管系の石灰化により循環器系障害の原因ともなっている (Braun J et.al., Am J Kidney Dis. 27:394-401, 1996, Goodman WG et.al., N Engl J Med 342:1478-1483, 2000, Kimura K et.al., Kidney Int. 71:S238-241, 1999)。このような場合、カルシウム・リン積の下方修正が病態の改善に有効である

(Geoffrey AB et.al., Am J Kidney Dis. 31:607-617, 1998)。本発明による化合物はカルシウム製剤とは異なる高リン血症改善薬であることから、血清中のカルシウム濃度を上昇させることなく血清中のリン濃度を低下させることができる。よって本発明による化合物は、血管におけるカルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患の治療に用いることができる。このような疾患としては、透析患者における心血管系の石灰化、加齢による動脈硬化、糖尿病性血管症、軟部組織石灰化、転移性石灰化、異所性石灰化が挙げられる。カルシウム・リン積の上昇はred eye、関節痛、筋肉痛、皮膚掻痒、心伝導障害、肺拡散障害、狭心症、心筋梗塞、心雑音や弁膜症による心不全といった病態の危険因子であることも認知されていることから (Tetsuo Tagami, 腎と透析vol.49:189-191, 2000)、これらの予防および治療にも用いることができる。

【0113】

(6) その他の高リン血症に関連する疾患

上記(1)～(5)以外に、副甲状腺機能低下症、偽性副甲状腺機能低下症、低カルシウム血症、高カルシウム尿症、、ビタミンD中毒症、末端肥大症、リン酸塩の過剰投与、アシドーシス、異化亢進状態、横紋筋融解症、溶血性貧血、更年期障害、悪性腫瘍、腫瘍崩壊症候群、および腫瘍性石灰沈着症も高リン血症を伴うことから、本発明による化合物はこれらの疾患の予防および治療に用いることもできる。

【0114】

本発明によれば、本発明による化合物を含んでなる、血清リン濃度低下剤が提供される。

【0115】

本発明によれば、本発明による化合物を含んでなる、リン酸輸送阻害剤が提供される。

【0116】

本発明によればまた、本発明による化合物をヒトまたはヒト以外の哺乳類に投与することを含んでなる、血清リン濃度の低下方法が提供される。

【0117】

本発明によれば、本発明による化合物をヒトまたはヒト以外の哺乳類に投与することを含んでなる、リン酸輸送の阻害方法が提供される。

【0118】

医薬製剤

本発明による化合物は、経口および非経口（例えば、口腔内、経鼻、経肺、直腸内、経皮、皮下、静脈内）のいずれかの投与経路で、ヒトおよびヒト以外の動物に投与することができる。従って、本発明による化合物は、投与経路に応じた適当な剤型に処方することができる。上記投与に適した剤形としては、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、軟膏剤、ハップ剤、エアゾール剤、坐剤、注射剤等が挙げられる。

【0119】

本発明による化合物それ自体を患者に投与することができるが、汎用の製剤用添加物とともに患者に投与することができる。

【0120】

本発明による医薬組成物は、周知の製剤技術に従って、本発明による化合物を下記に記載した添加物とともに使用することにより製造することができる。

【0121】

例えば、本発明による化合物と適当な製剤用添加物を使用し、従来汎用の方法により経口製剤、すなわち錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤を製造することができる。経口製剤に使用できる添加物は、賦形剤、結合剤、崩壊剤、滑沢剤等のなかから適当なものを単独あるいは組み合わせて用いることができる。賦形剤としては、例えば、乳糖、マンニトール、トウモロコシデンプン、炭酸カルシウムなどが挙げられる。結合剤としては、例えば、アラビアゴム、トラガント、ゼラチン、メチルセルロースなどが挙げられる。崩壊剤としては、例えば、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウムなどが挙げられる。滑沢剤としては、例えば、タルク、ステアリン酸マグネシウムなどが挙げられる。

【0122】

本発明による化合物を含有する経口製剤は、周知の方法に従って、コーティン

グ剤を用いてコーティングを施すこともできる。コーティング剤としては、例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、アミノアルキルメタアクリレートコポリマー、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、カルボキシメチルエチルセルロースなどを用いることができる。

【0123】

本発明による化合物の腸管からのリン吸収を阻害する作用を効果的に引き出すために経口製剤に改変を加えてもよい。

【0124】

本発明による化合物は経口投与された場合、小腸上皮細胞におけるリン酸輸送担体を阻害した後、体内に吸収されて血管内皮細胞、肺上皮細胞、腎臓上皮細胞、骨芽細胞等におけるリン酸輸送担体を阻害する可能性を有する。従って、本発明による化合物が腸管からのリン酸吸収を阻害するとともに、腎臓でのリン酸吸収を阻害することにより、相乗的にかつ効果的に血清リン酸濃度を低下させる可能性を有する。本発明による化合物が体内に吸収された場合には、未知の毒性を引き起こす可能性も否定できない。そこで本発明による化合物を腸管から吸収させることなく体外からのリン酸吸収にとって最初の関門である小腸上皮のみを特異的に阻害する工夫を施してもよい。例えば、本発明の化合物に不活性な水溶性の高分子を結合させることにより、水溶性と分子量の増大をもたらすことで化合物自身の腸管からの吸収を防いでもよい。水溶性の高分子としては、例えば、ポリエチレングリコール、デキストラン、ゼラチンなどを用いることができる。

【0125】

本発明による経口製剤はまた、経口投与後、腸管で特異的に溶解させるために腸溶コーティングを施してもよい。腸溶コーティングは、周知の方法に従って、腸溶コーティング剤を用いて行うことができる。腸溶コーティング剤としては、例えば、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートサクシネート、カルボキシメチルエチルセルロース、メタアクリル酸コポリマーなどが挙げられる。

【0126】

本発明による経口製剤には更に、経口投与後、腸管で迅速に溶解させて有効成

分の濃度を高める発泡性を発揮する物質を添加することができる。溶解時に発泡性を発揮する物質としては、例えば、炭酸水素ナトリウムとクエン酸の組み合わせなどを用いることができる。

【0127】

本発明による経口製剤には更にまた、経口投与後、腸管における滞留性を向上させる物質を添加することができる。滞留性を向上させる物質としては、溶解時に粘性を示す物質が挙げられ、例えば、アルギン酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシルビニルポリマー、キトサンなどを用いることができる。

【0128】

本発明による経口製剤においては上記改変を適宜組み合わせてもよい。

【0129】

本発明による化合物と適当な製剤用添加物を使用し、従来汎用の方法により注射剤を製造することができる。注射剤に使用できる添加物は、希釈剤、pH調整剤、等張化剤、溶解補助剤、防腐剤等のなかから適当なものを単独あるいは組み合わせで用いることができる。希釈剤としては、例えば、注射用蒸留水などが挙げられる。pH調整剤としては、例えば、塩酸、水酸化ナトリウム、酢酸と酢酸ナトリウムの組み合わせ、リン酸水素二ナトリウムとリン酸二水素ナトリウムの組み合わせなどが挙げられる。等張化剤としては、例えば、塩化ナトリウム、ブドウ糖、マンニトール、グリシンなどが挙げられる。溶解補助剤としては、例えば、エタノール、ポリソルベート20、ポリソルベート80、ショ糖脂肪酸エステル、プロピレングリコールなどが挙げられる。防腐剤としては、例えば、クロロブタノール、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウムなどが挙げられる。

【0130】

本発明による化合物の投与量は、患者の年齢、体重、性別、疾患の相違、症状の程度などを考慮して、個々の場合に依じて適宜決定されるが、例えば、0.1～1000mg/kg、好ましくは、0.5～100mg/kg、より好ましく

は、1～20 mg/kg の範囲であり、これを1日1回または数回に分けて投与する。

【0131】

【実施例】

以下、実施例を挙げて具体的に説明するが、本発明の範囲はこれらの実施例によって制限されるものではない。

【0132】

実施例1

化合物1 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

メチル 2-アミノベンゾエート (化合物A) (2.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.0 ml)、3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド (化合物B) (3.14 g) をそれぞれ加え、同温度にて30分攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 2-[(3, 4-ジメトキシベンゾイル) アミノ] ベンゾエート (4.17 g, 収率100%) を得た。

【0133】

上記反応で得られた、メチル 2-[(3, 4-ジメトキシベンゾイル) アミノ] ベンゾエート (4.17 g) を、エタノール (40.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (20.0 ml) を加え、加熱還流下で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロート (φ40 mm) を用いて濾過し、結晶をエーテルにて洗浄し、ヒドラジン化合物であるN-(2-ヒドラジノカルボニル-フェニル)-3, 4-ジメトキシベンズアミド (3.55 g, 収率91.3%) を得た。

【0134】

N-(2-ヒドラジノカルボニル-フェニル)-3, 4-ジメトキシベンズア

ミド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて触媒量の酢酸、トランス-シンナムアルデヒド (化合物 C) (40.0 μ l) を添加し、加熱還流下にて 30 分攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロート (ϕ 21 mm) を用いて濾過し、結晶をトルエン、ヘキサンを用いて洗浄した。結晶を真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物 1 (39.0 mg、収率 57.0 %) を得た。

質量分析 (ESI-MS) 428 (M-1)

【0135】

化合物 2 N-[2-(2-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

【0136】

化合物 3 3,4-ジメトキシ-N-[2-(2-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 416 (M-1)

【0137】

化合物 4 3,4-ジメトキシ-N-[2-(2-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

【0138】

化合物 5 3,4-ジメトキシ-N-[2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

【0139】

化合物 6 N- [2- (3, 5-ジ-tert-ブチル-4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

【0140】

化合物 7 3, 4-ジメトキシ-N- [2- (2-メチル-3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 442 (M-1)

【0141】

化合物 8 N- [2- (3, 5-ビス-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 538 (M-1)

【0142】

化合物 9 N- [2- (3-シアノ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 427 (M-1)

【0143】

化合物 10 N- [2- (2-ブロモ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 10 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

【0144】

化合物 11 N- [2- (4-ヒドロキシ-3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 11 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 448 (M-1)

【0145】

化合物12 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(3, 4, 5-トリメトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物12を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 492 (M-1)

【0146】

化合物13 N-[4-ブロモ-2-(3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物13を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

【0147】

化合物14 N-[4-ブロモ-2-(2-ブロモ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物14を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

【0148】

化合物15 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物15を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

【0149】

化合物16 N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物16を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

【0150】

化合物17 N-[2-(ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 17 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 402 (M-1)

【0151】

化合物 18 N-[2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 18 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 418 (M-1)

【0152】

化合物 19 N-[2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 19 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 418 (M-1)

【0153】

化合物 20 3,4-ジメトキシ-N-[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 20 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 416 (M-1)

【0154】

化合物 21 N-[2-(フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 21 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 392 (M-1)

【0155】

化合物 22 3,4-ジメトキシ-N-[2-(5-メチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 22 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 406 (M-1)

【0156】

化合物 23 3,4-ジメトキシ-N-[2-(チオフェン-2-イルメチレン

ーヒドラジノカルボニル) ーフェニル] ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 23 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 408 (M-1)

【0157】

化合物 24 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(チオフェン-3-イルメチレン
ーヒドラジノカルボニル) ーフェニル] ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 24 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 408 (M-1)

【0158】

化合物 25 N-[2-(2, 4-ジヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカ
ルボニル) ーフェニル] ー3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 25 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

【0159】

化合物 26 N-[2-(3, 4-ジヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカ
ルボニル) ーフェニル] ー3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 26 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

【0160】

化合物 27 N-[2-(ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) ーフェニル]
ー2-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 27 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 360 (M-1)

【0161】

化合物 28 N-[4-ブロモ-2-(2-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジ
ノカルボニル) ーフェニル] ー3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 28 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 500 (M-1)

【0162】

化合物 29 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 29 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.55 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.32 (1H, bs), 7.49-7.67 (6H, m), 7.40 (1H, q, $J=4.56$ Hz), 7.13 (1H, q, $J=5.53$ Hz), 6.93 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 3.98 (3H, s), 3.94 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 500 ($M-1$)

【0163】

化合物 30 N-[4-ブromo-2-(2-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 30 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 ($M-1$)

【0164】

化合物 31 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 31 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 ($M-1$)

【0165】

化合物 32 N-[2-(3-クロロ-4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 32 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 ($M-1$)

【0166】

化合物 33 3,4-ジメトキシ-N-[2-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 33 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 486 ($M-1$)

【0167】

化合物 34 N-[2-(3-プロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 34 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 512 (M-1)

【0168】

化合物 35 N-[2-(3-クロロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 35 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

【0169】

化合物 36 N-[2-(4-ヒドロキシ-3,5-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 36 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

【0170】

化合物 37 N-[2-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 37 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

【0171】

化合物 38 2-フルオロ-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 38 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

【0172】

化合物 39 2-フルオロ-N-[2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 39 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

【0173】

化合物 40 2-フルオロ-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 40 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0174】

化合物 41 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 41 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

【0175】

化合物 42 N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 42 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

【0176】

化合物 43 N-[2-(2,5-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 43 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

【0177】

化合物 44 N-[2-(2-フルオロ-5-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 44 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 488 (M-1)

【0178】

化合物 45 2-フルオロ-N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 45 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 390 (M-1)

【0179】

化合物 46 N-[2-(2,5-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 46 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

【0180】

化合物 47 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシー-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 47 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 390 (M-1)

【0181】

化合物 48 N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシー-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 48 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 390 (M-1)

【0182】

化合物 49 4-メトキシー-N-[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 49 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 386 (M-1)

【0183】

化合物 50 N-[2-(3-ヒドロキシー-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシー-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 50 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

【0184】

化合物 51 4-メトキシー-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ

ノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 386 (M-1)

【0185】

化合物 5 2 N- [2- (4-アリルオキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 458 (M-1)

【0186】

化合物 5 3 N- [2- (3, 5-ジメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

【0187】

化合物 5 4 3, 4-ジメトキシ-N- {2- [3- (3-トリフルオロメチル-フェノキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

【0188】

化合物 5 5 N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

【0189】

化合物 5 6 N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

【0190】

化合物 57 3, 5-ジメトキシ-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 57 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 416 (M-1)

【0191】

化合物 58 N-[2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 58 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 418 (M-1)

【0192】

化合物 59 N-[4-ブロモ-2-(3-クロロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 59 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 516 (M-1)

【0193】

化合物 60 N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 60 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 516 (M-1)

【0194】

化合物 61 N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 61 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 500 (M-1)

【0195】

化合物 62 N-[4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 62 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

【0196】

化合物 63 N-[4-ブromo-2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 63 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

【0197】

化合物 64 N-[4-ブromo-2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 64 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

【0198】

化合物 65 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 65 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

【0199】

化合物 66 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 66 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

【0200】

化合物 67 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 67 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

【0201】

化合物 68 N-[4-クロロ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 68 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 9.33 (1H, s), 8.72 (1H, d, $J=8.76\text{ Hz}$), 8.21 (1H, s), 7.48–7.68 (6H, m), 7.20–7.25 (1H, m), 6.92 (1H, d, $J=8.56\text{ Hz}$), 3.97 (3H, s), 3.93 (3H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 450 ($M-1$)

【0202】

化合物 69 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 69 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 ($M-1$)

【0203】

化合物 70 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 70 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 ($M-1$)

【0204】

化合物 71 N-[5-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 71 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 ($M-1$)

【0205】

化合物 72 N-[5-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 72 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 ($M-1$)

【0206】

化合物 73 N-[5-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノ

カルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 73 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

【0207】

化合物 74 N-[5-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 74 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 (M-1)

【0208】

化合物 75 N-[5-クロロ-2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 75 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 (M-1)

【0209】

化合物 76 4-フルオロ-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 76 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 379 (M-1)、757 (2M-1)

【0210】

化合物 77 4-フルオロ-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 77 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

【0211】

化合物 78 4-フルオロ-N-[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 78 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0212】

化合物 79 4-フルオロ-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ
ノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 79 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0213】

化合物 80 4-フルオロ-N-[2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒド
ラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 80 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

【0214】

化合物 81 3-フルオロ-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ
ジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 81 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

【0215】

化合物 82 3-フルオロ-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ
ジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 82 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 757 (2M-1)

【0216】

化合物 83 3-フルオロ-N-[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ
ノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 83 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0217】

化合物 84 3-フルオロ-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ
ノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 84 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0218】

化合物 85 3-フルオロ-N-[2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 85 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

【0219】

化合物 86 3-フルオロ-N-[2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 86 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

【0220】

化合物 87 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 87 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 582、584 (M-1)

【0221】

化合物 88 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 88 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.49 (1H, d, $J=8.08$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.49-7.60 (4H, m), 7.41 (1H, d, $J=9.04$ Hz), 6.94 (1H, d, $J=8.56$ Hz), 3.98 (3H, s), 3.94 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 538、540 (M-1)

【0222】

化合物 89 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン

ーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3, 5ージメトキシーベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物89を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 504、506 (M-1)

【0223】

化合物90 Nー[2ー(4ークロロー3ートリフルオロメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4ーメトキシーベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物90を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 474 (M-1)

【0224】

化合物91 Nー[4ープロモー2ー(3, 4ージメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3, 4ージメトキシーベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物91を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 9.53 (1H, s), 8.61 (1H, d, J=9.04 Hz), 8.21 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.59-7.62 (4H, m), 7.46-7.50 (1H, m), 7.17 (1H, d, J=7.56 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.28 Hz), 3.97 (3H, s), 3.93 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

【0225】

化合物92 Nー[4ークロロー2ー(3, 4ージメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3, 4ージメトキシーベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物92を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 9.60 (1H, s), 8.65 (1H, d, J=9.04 Hz), 8.21 (1H, s), 7.44-7.62 (6H, m), 7.17 (1H, d, J=7.80 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.32 Hz), 3.97 (3H, s), 3.92 (3H, s), 2.28 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 464 (M-1)

【0226】

化合物 93 N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 93 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

【0227】

化合物 94 N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 94 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 400 (M-1)

【0228】

化合物 95 N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 95 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

【0229】

化合物 96 N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 96 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

【0230】

化合物 97 N- [4-プロモ-2- (3-プロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 97 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 590 (M-1)

【0231】

化合物 98 N- [2- (3-プロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-クロロ-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 98 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

【0232】

化合物 99 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 99 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 510 (M-1)

【0233】

化合物 100 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 100 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 482 (M-1)

【0234】

化合物 101 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 101 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 468、470 (M-1)

【0235】

化合物 102 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 102 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 468、470 (M-1)

【0236】

化合物 103 3, 4-ジメトキシー-N-[2-(3-ニトロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 103 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 447 (M-1)

【0237】

化合物 104 N-[2-(4-ジメチルアミノベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 104 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 445 (M-1)

【0238】

化合物 105 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 105 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 458 (M-1)

【0239】

化合物 106 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 106 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 456 (M-1)

【0240】

化合物 107 N-[4-ブromo-2-(3-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 107 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 472、474 (M-1)

【0241】

化合物 108 N-[4-ブromo-2-(4-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 108 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 472、474 (M-1)

【0242】

化合物 109 N-[4-ブromo-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 109 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 456、458 (M-1)

【0243】

化合物 110 N-[4-ブromo-2-(ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 110 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 483 (M-1)

【0244】

化合物 111 N- [4-クロロ-2- (ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 111 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

【0245】

化合物 112 4-メトキシ-N- [2- (ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 112 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 373 (M-1)

【0246】

化合物 113 4-フルオロ-N- [2- (ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 113 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0247】

化合物 114 N- [4-ブロモ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 114 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 498 (M-1)

【0248】

化合物 115 N- [4-ブロモ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 115 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 498、500 (M-1)

【0249】

化合物 116 N-[4-ブromo-2-(3-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 116 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 516, 518 (M-1)

【0250】

化合物 117 N-[4-ブromo-2-(4-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 117 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 514, 516 (M-1)

【0251】

化合物 118 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 118 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

【0252】

化合物 119 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 119 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

【0253】

化合物 120 N-[2-(3-フルオロベンジリデン)-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-トリフルオロメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 120 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 444 (M-1)

【0254】

化合物 121 N-[2-(4-フルオロベンジリデン)-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-トリフルオロメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 121 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 444 (M-1)

【0255】

化合物 122 N-[2-(3-クロロベンジリデン)-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-トリフルオロメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 122 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 459, 461 (M-1)

【0256】

化合物 123 N-[2-(4-クロロベンジリデン)-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-トリフルオロメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 123 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 459, 461 (M-1)

【0257】

化合物 124 N-[2-(4-メチルベンジリデン)-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-トリフルオロメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 124 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

【0258】

化合物 125 N-[4-(3-ジメチルアミノプロポキシ)-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

N-(2-クロロエチル)-N,N-ジメチルアミン塩酸塩を 3-ジメチルアミノプロピルクロライド塩酸塩に変更した以外は実施例 2 に記載の方法に従って、表題の化合物 125 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 521, 523 (M-1)

【0259】

化合物 126 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 126 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

【0260】

化合物 127 N- [4-プロモ-2- (3, 4-ジメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 127 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 540 (M-1)

【0261】

化合物 128 N- [4-プロモ-2- (3, 4-ジメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 128 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

【0262】

化合物 129 N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 129 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0263】

化合物 130 N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 130 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 9.69 (1H, s), 9.28 (1H, s), 8.77 (1H, dd, $J=1.44\text{ Hz}$, $J=4.88\text{ Hz}$), 8.66 (1H, d, $J=7.80\text{ Hz}$), 8.25-8.33 (2H, m), 7.81 (2H, s), 7.50-7.60 (2H, m), 7.43 (1H, dd, $J=4.88\text{ Hz}$, $J=8.04\text{ Hz}$), 7.05-7.15 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0264】

化合物 131 N- [2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 131 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0265】

化合物 132 N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 132 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0266】

化合物 133 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 133 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0267】

化合物 134 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 134 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0268】

化合物 135 N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 135 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0269】

化合物 136 N-[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 136 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0270】

化合物 137 N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 137 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0271】

化合物 138 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 138 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0272】

実施例 2

化合物 139 N-[4-(2-ジメチルアミノ-エトキシ)-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って合成した N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヒドロキシフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド (50 mg) を、無水 DMF (1.5 ml) に溶解させ、室温にて NaH (60% in oil, 20 mg) を加え、同温度にて 5 分間攪拌した。続いて、室温にて N-(2-クロロエチル)-N,N-ジメチルアミン塩酸塩 (47 mg) を加え、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、氷冷下にて蒸留水を滴下し、酢酸エチルにて分液抽出を行ない、得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥させ有機層を減圧下にて濃縮した。得られた残査をプレパラティブ TLC にて精製し、表題の化合物 139 を (32 mg、収率 57.1%) 得た。

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0273】

化合物 140 N-[4-(2-ジエチルアミノ-エトキシ)-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

N-(2-クロロエチル)-N,N-ジメチルアミン塩酸塩を 2-ジエチルアミノエチルクロライド塩酸塩に変更した以外は実施例 2 に記載の方法に従って、

表題の化合物 140 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

【0274】

化合物 141 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 141 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

【0275】

化合物 142 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 142 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

【0276】

化合物 143 3,4-ジメトキシ-N-[4-メトキシ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 143 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

【0277】

化合物 144 3,4-ジメトキシ-N-[4-メトキシ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 144 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

【0278】

化合物 145 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 145 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 460 (M-1)

【0279】

化合物 146 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

ル) - 4 - メチル - フェニル] - 3, 4 - ジメトキシ - ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 146 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

【0280】

化合物 147 N - [2 - (4 - フルオロ - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニ
ル) - 4 - メチル - フェニル] - 3, 4 - ジメトキシ - ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 147 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

【0281】

化合物 148 3, 4 - ジメトキシ - N - [4 - メチル - 2 - (3 - メチル - ベ
ンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 148 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

【0282】

化合物 149 3, 4 - ジメトキシ - N - [4 - メチル - 2 - (4 - メチル - ベ
ンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 149 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

【0283】

化合物 150 N - [2 - (3, 4 - ジメチル - ベンジリデン - ヒドラジノカル
ボニル) - 4 - メチル - フェニル] - 3, 4 - ジメトキシ - ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 150 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 444 (M-1)

【0284】

化合物 151 フラン - 2 - カルボキシリック アシッド [4 - ブロモ - 2 -
(3 - フルオロ - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 151 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 428 (M-1)

【0285】

化合物 152 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 152 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 428 (M-1)

【0286】

化合物 153 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 153 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 426 (M-1)

【0287】

化合物 154 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 154 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 424 (M-1)

【0288】

化合物 155 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 155 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 438 (M-1)

【0289】

化合物 156 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 156 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 513、514 (M-1)

【0290】

化合物 157 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ア

ミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 157 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

【0291】

化合物 158 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 158 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

【0292】

化合物 159 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 159 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

【0293】

化合物 160 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 160 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

【0294】

化合物 161 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 161 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454、456 (M-1)

【0295】

化合物 162 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-

2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 162 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

【0296】

実施例 3

化合物 163 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド 塩酸塩

実施例 1 に記載の方法に従って合成した化合物 138 (50 mg) に室温にて 10%-塩酸メタノールを溶液 (1.0 ml) を加え、さらにジエチルエーテル (5.0 ml) を加え 30 秒間攪拌した。反応液をそのまま桐山ロート (ϕ 21 mm) を用いて濾過し、結晶をジエチルエーテルにより洗浄し、表題の化合物 163 (47 mg、収率 85.6%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (MeOH- d_4 , 400 MHz): δ 8.97 (2H, d, $J=6.84$ Hz), 8.49 (1H, d, $J=8.08$ Hz), 8.41 (2H, d, $J=6.56$ Hz), 8.23 (1H, s), 7.84 (1H, d, $J=6.56$ Hz), 7.56-7.61 (2H, m), 7.44 (1H, d, $J=7.80$ Hz), 7.28 (1H, dd, $J=7.32$ Hz, $J=7.32$ Hz), 7.12 (1H, d, $J=7.80$ Hz), 2.23 (3H, s), 2.22 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0297】

化合物 164 N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 164 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (MeOH- d_4 , 400 MHz): δ 9.22 (1H, s), 8.87 (1H, d, $J=5.4$ Hz), 8.83 (1H, d, $J=8.04$ Hz), 8.43 (1H, d, $J=8.32$ Hz), 8.25 (1H, s), 7.97-8.04 (1H, m), 7.81 (1H, dd, $J=1.24$ Hz, $J=7$

. 84 Hz), 7.64 (2H, d, J=8.04 Hz), 7.54-7.60 (1H, m), 7.23-7.29 (1H, m), 7.18 (2H, d, J=7.80 Hz), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0298】

化合物 165 N-[2-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 165 を製造した。

¹H-NMR (CDCl₃, 400 MHz): δ 9.92 (1H, s), 9.29 (1H, s), 8.75-8.78 (2H, m), 8.30-8.40 (1H, m), 8.15 (1H, s), 7.55-7.65 (5H, m), 7.42-7.49 (2H, m), 7.15-7.25 (1H, m), 2.32 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0299】

化合物 166 N-[4-ブロモ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 166 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

【0300】

化合物 167 N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 167 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

【0301】

化合物 168 N-[4-ブロモ-2-(3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 168 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

【0302】

化合物 169 N- [4-ブロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 169 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 435、437 (M-1)

【0303】

化合物 170 N- [4-ブロモ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 170 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 451、452 (M-1)

【0304】

化合物 171 N- [4-ブロモ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 171 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 525、527 (M-1)

【0305】

化合物 172 N- [4-ブロモ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 172 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 441、442 (M-1)

【0306】

化合物 173 N- [4-ブロモ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 173 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

【0307】

化合物 174 N- [4-ブロモ-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 174 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 435 (M-1)

【0308】

化合物 175 N-[4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 175 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437、438 (M-1)

【0309】

化合物 176 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 176 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 451、452 (M-1)

【0310】

化合物 177 N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 177 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 524、525 (M-1)

【0311】

化合物 178 N-[4-ブロモ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 178 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 466、468 (M-1)

【0312】

化合物 179 N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 179 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 466 (M-1)

【0313】

化合物 180 N-[4-ブロモ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 180 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

【0314】

化合物 181 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 181 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462、464 (M-1)

【0315】

化合物 182 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 182 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 476、478 (M-1)

【0316】

化合物 183 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 183 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 550 (M-1)

【0317】

化合物 184 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 184 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395、397 (M-1)

【0318】

化合物 185 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 185 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

【0319】

化合物 186 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 186 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

【0320】

化合物 187 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 187 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

【0321】

化合物 188 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 188 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405、407 (M-1)

【0322】

化合物 189 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 189 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 479、480 (M-1)

【0323】

化合物 190 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 190 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395、397 (M-1)

【0324】

化合物 191 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 191 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

【0325】

化合物 192 N- [4-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 192 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

【0326】

化合物 193 N- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 193 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

【0327】

化合物 194 N- [4-クロロ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 194 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 479 (M-1)

【0328】

実施例 4

化合物 195 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (ピリジン-4-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

メチル 2-アミノ-5-ブromoベンゾエート (化合物 A) (2.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (1.0 ml)、3- (クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (2.0 g) をそれぞれ加え、同温度にて 3 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-ブromo-2- [3- (クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (3.32 g, 収率 100%) を得た。

【0329】

続いて、メチル 5-ブロモ-2-[3-(クロロメチル)ベンゾイル]アミノベンゾエート (1.5 g) を、無水塩化メチレンに溶解させ、室温にてトリエチルアミン (2.0 ml)、4-メルカプトピリジン (化合物B') (880 mg) を加え、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣にジエチルエーテルを加え結晶化させ、結晶を桐山ロート (ϕ 2.1 mm) を用いてろ過し、ジエチルエーテルを用いて洗浄し、有用中間体であるメチル 5-ブロモ-2-(3-[(4-ピリジルスルファニル)メチル]ベンゾイルアミノ)ベンゾエート (1.20 g、収率67%) を得た。

【0330】

上記反応で得られた、メチル 5-ブロモ-2-(3-[(4-ピリジルスルファニル)メチル]ベンゾイルアミノ)ベンゾエート (1.20 g) を、エタノール (25.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (2.0 ml) を加え、加熱還流下で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロート (ϕ 2.1 mm) を用いて濾過し、結晶をジエチルエーテルにて洗浄し、ヒドラジン化合物である N-(4-ブロモ-2-ヒドラジノカルボニルフェニル)-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド (753 mg、収率65.4%) を得た。

【0331】

N-(4-ブロモ-2-ヒドラジノカルボニルフェニル)-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて触媒量の酢酸、3-フルオロベンズアルデヒド (化合物C) (50.0 μ l) を添加し、加熱還流下にて1時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロート (ϕ 2.1 mm) を用いて濾過し、結晶をトルエン、ヘキサンを用いて洗浄した。結晶を真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物 195 (27.0 mg、収率43.6%) を得た。

質量分析 (ESI-MS) 561、563 (M-1)

【0332】

化合物 196 N-[4-プロモ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 196 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

【0333】

化合物 197 N-[4-プロモ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 197 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

【0334】

化合物 198 N-[4-プロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 198 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

【0335】

化合物 199 N-[4-プロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 199 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 571 (M-1)

【0336】

化合物 200 N-[4-プロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物200を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 647 (M-1)

【0337】

化合物201 N-[4-ブromo-2-(1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物201を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

【0338】

化合物202 N-[4-ブromo-2-(4,5-ジメチルフラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物202を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 499 (M-1)

【0339】

化合物203 N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド 塩酸塩

実施例3に記載の方法に従って、表題の化合物203を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.92-8.98 (2H, m), 8.49 (1H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8.34-8.40 (2H, m), 8.26 (1H, s), 8.81-8.87 (1H, m), 7.64 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.55-7.61 (1H, m), 7.25-7.31 (1H, m), 7.15-7.20 (2H, m), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0340】

化合物204 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物204を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

【0341】

化合物 205 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 205 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

【0342】

化合物 206 N-[4-ヨード-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 206 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

【0343】

化合物 207 N-[4-ヨード-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 207 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

【0344】

化合物 208 N-[2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 208 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 556 (M-1)

【0345】

化合物 209 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 209 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 630 (M-1)

【0346】

化合物 210 N-[2-(1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 210 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 346 (M-1)

【0347】

化合物 211 N-[4-ブromo-2-(1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 211 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 424 (M-1)

【0348】

化合物 212 N-[4-クロロ-2-(1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 212 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 380 (M-1)

【0349】

化合物 213 N-{2-[1-(3-フルオロフェニル)-エチリデン-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 213 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

【0350】

化合物 214 N-{4-ブromo-2-[1-(3-フルオロフェニル)-エチリデン-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 214 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 512、514 (M-1)

【0351】

化合物 215 N-[4-ブromo-2-(1-m-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 215 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 449、451 (M-1)

【0352】

化合物 216 N-[4-ブromo-2-(1-p-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 216 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 449 (M-1)

【0353】

化合物 217 N-[4-クロロ-2-(1-p-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 217 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

【0354】

化合物 218 N-[2-(4,5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 218 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0355】

化合物 219 N-[2-(4,5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-isonicotinamide

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 219 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0356】

化合物 220 N-[4-ブromo-2-(4,5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 220 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

【0357】

化合物 221 N-[4-ブromo-2-(4,5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-isonicotinamide

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 221 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439, 441 (M-1)

【0358】

化合物 222 N- [4-クロロ-2-(4, 5-ジメチル-フラン-2-イル
メチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 222 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

【0359】

化合物 223 N- [4-クロロ-2-(4, 5-ジメチル-フラン-2-イル
メチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 223 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

【0360】

化合物 224 N- [2-(ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]
]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 224 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 342 (M-1)

【0361】

化合物 225 N- [2-(2-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニ
ル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 225 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 360 (M-1)

【0362】

化合物 226 N- [2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニ
ル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 226 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 360 (M-1)

【0363】

化合物 227 N- [2-(ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5-
ジメトキシ-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 227 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

【0364】

化合物 228 N-[2-(2-プロモベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 228 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 421 (M-1)

【0365】

化合物 229 N-[2-(2-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 229 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 356 (M-1)

【0366】

化合物 230 N-[4,5-ジメトキシ-2-(2-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 230 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 476 (M-1)

【0367】

化合物 231 N-[2-(2-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 231 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

【0368】

化合物 232 3,4-ジメトキシ-N-[2-(6-メトキシナフタレン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 232 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 482 (M-1)

【0369】

化合物 233 N-[2-(ビフェニル-4-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 233 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 478 (M-1)

【0370】

化合物 234 N-[2-(4-ブロモベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 234 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

【0371】

化合物 235 N-[2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 235 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 368 (M-1)

【0372】

化合物 236 2-フルオロ-N-[2-(2-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 236 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

【0373】

化合物 237 2-フルオロ-N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 237 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

【0374】

化合物 238 2-フルオロ-N-[2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 238 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0375】

化合物 239 N-[2-(3-tert-ブチル-2-ヒドロキシベンジリ

デン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 239 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

【0376】

化合物 240 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(4-ニトロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 240 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 447 (M-1)

【0377】

化合物 241 N-[2-(4-ジエチルアミノ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 241 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 473 (M-1)

【0378】

化合物 242 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヒドロキシ-フェニル]-3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 242 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 436、437 (M-1)

【0379】

化合物 243 N-[4-ブロモ-2-(ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 243 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 483 (M-1)

【0380】

化合物 244 N-[4-クロロ-2-(ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 244 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

【0381】

化合物 245 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 245 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 403 (M-1)

【0382】

化合物 246 N-[4-クロロ-2-(6-メチル-ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 246 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 451 (M-1)

【0383】

化合物 247 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(6-メチル-ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 247 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 417 (M-1)

【0384】

化合物 248 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-tert-ブチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 248 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 490、492 (M-1)

【0385】

化合物 249 N-[2-(1-m-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 249 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0386】

化合物 250 N-[4-クロロ-2-(1-m-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 250 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

【0387】

化合物251 N-[2-(1-p-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物251を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0388】

化合物252 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド 塩酸塩

実施例3に記載の方法に従って、表題の化合物252を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (MeOH- d_4 , 400MHz): δ 9.21-9.25 (1H, m), 8.79-8.93 (2H, m), 8.34-8.39 (1H, m), 8.25 (1H, s), 8.01 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 8.00-8.15 (1H, m), 7.71 (1H, dd, $J=8.08\text{Hz}$, $J=2.20\text{Hz}$), 7.63 (2H, d, $J=8.32\text{Hz}$), 7.18 (2H, d, $J=8.08\text{Hz}$), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 437、438 (M-1)

【0389】

化合物253 N-[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド 塩酸塩

実施例3に記載の方法に従って、表題の化合物253を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.96-8.99 (2H, m), 8.49 (1H, d, $J=8.08\text{Hz}$), 8.42 (2H, dd, $J=1.20\text{Hz}$, $J=5.60\text{Hz}$), 8.27 (1H, s), 7.85 (1H, dd, $J=1.20\text{Hz}$, $J=7.80\text{Hz}$), 7.51-7.61 (3H, m), 7.18-7.31 (3H, m), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

【0390】

化合物255 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -4- (ピリジン-4-イルスルファニルメチル)
)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 255 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

【0391】

化合物 256 N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジ
ジノカルボニル) -フェニル] -4- (ピリジン-4-イルスルファニルメチル)
)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 256 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

【0392】

化合物 257 N-[4-ブロモ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ
ノカルボニル) -フェニル] -4- (ピリジン-4-イルスルファニルメチル)
)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 257 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

【0393】

化合物 258 N-[4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ
ノカルボニル) -フェニル] -4- (ピリジン-4-イルスルファニルメチル)
)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 258 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

【0394】

化合物 259 N-[4-ブロモ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒ
ドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (ピリジン-4-イルスルファニルメ
チル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 259 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 571 (M-1)

【0395】

化合物 260 N- [4-ブromo-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (ピリジン-4-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 260 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 645、647 (M-1)

【0396】

化合物 261 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 261 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

【0397】

化合物 262 N- [4-ブromo-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 262 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

【0398】

化合物 263 N- [4-ブromo-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 263 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

【0399】

化合物 264 N- [4-ブromo-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 264 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 526 (M-1)

【0400】

化合物 265 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 265 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 540 (M-1)

【0401】

化合物 266 N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 266 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 612、614 (M-1)

【0402】

化合物 267 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 267 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.60 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.28 (1H, bs), 8.05 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 8.01 (1H, m), 7.86 (1H, m), 7.73 (1H, dd, $J=9.0$ Hz, $J=2.2$ Hz), 7.60 (2H, m), 7.52 (1H, m), 7.46 (1H, t, $J=7.7$ Hz), 7.19 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 4.44 (2H, s), 2.30 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

【0403】

化合物 268 N-[4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 268 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.38 (3H, s), 4.44 (2H, s), 7.26 (1H, d, $J=7.4\text{Hz}$), 7.46 (2H, m), 7.59 (1H, m), 7.66 (1H, dd, $J=9.0\text{Hz}$, $J=2.4\text{Hz}$), 7.72 (1H, m), 7.86 (2H, m), 7.97-8.05 (2H, m), 8.29-8.34 (2H, m), 8.57 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

【0404】

化合物269 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物269を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400MHz) : δ 2.48-2.53 (3H, m), 4.43 (2H, s), 7.27-7.82 (9H, m), 7.96 (3H, m), 8.57 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 549 (M-1)

【0405】

化合物270 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物270を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 4.44 (2H, s), 7.20 (1H, m), 7.45 (1H, m), 7.59 (1H, m), 7.66 (1H, dd, $J=9.0\text{Hz}$, $J=2.3\text{Hz}$), 7.75 (1H, dd, $J=9.0\text{Hz}$, $J=2.3\text{Hz}$), 7.87 (2H, m), 7.99-8.06 (3H, m), 8.30 (1H, s), 8.36 (1H, s), 8.57 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 553 (M-1)

【0406】

化合物 271 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 271 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 4.44 (2H, s), 7.19 (1H, m), 7.45 (2H, m), 7.59-7.77 (3H, m), 7.86 (2H, m), 7.97-8.01 (2H, m), 8.29-8.36 (2H, m), 8.58 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 553 (M-1)

【0407】

化合物 272 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 272 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 4.44 (2H, s), 7.45 (1H, m), 7.59 (1H, m), 7.67 (1H, m), 7.76 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.85 (2H, m), 7.97-8.06 (3H, m), 8.29 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.57 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=1.7\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 635 (M-1)

【0408】

化合物 273 N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシピロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 273 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.76 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.50 (2H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 3.60 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.80 (2H, s), 7.20 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.52 (3H, m), 7.66 (1H, s)

, 7.74 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.96 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.05 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$) 8.30 (1H, s), 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 552 (M-1)

【0409】

化合物 274 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 274 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.76 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.50 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.60 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.80 (2H, s), 7.27 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.52 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.74 (3H, m), 7.96 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.01 (1H, m), 8.33 (1H, s), 8.63 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 538 (M-1)

【0410】

化合物 275 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 275 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.76 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.51 (2H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 3.60 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.81 (2H, s), 7.25-7.35 (2H, m), 7.52 (2H, m), 7.63 (1H, m), 7.71-7.77 (2H, m), 7.96 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.06 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.62 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 538 (M-1)

【0411】

化合物 276 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 276 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.76 (2H, m), 2.51 (2H, m), 3.60 (2H, m), 3.81 (2H, m), 7.19 (2H, m), 7.51 (2H, m), 7.75-8.06 (6H, m), 8.35 (1H, m), 8.60 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

【0412】

化合物 277 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 277 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.76 (2H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.60 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 3.81 (2H, s), 7.19 (1H, m), 7.46-7.54 (3H, m), 7.60 (1H, m), 7.70 (1H, m), 7.77 (1H, dd, $J=9.1\text{ Hz}$, $J=2.3\text{ Hz}$), 7.96 (2H, m), 8.07 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.62 (1H, d, $J=9.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

【0413】

化合物 278 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 278 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.76 (2H, m), 2.50 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.60 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.80 (2H, s), 7.52 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.69 (1H

, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=2.0\text{ Hz}$), 7.95 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.05-8.07 (2H, m), 8.33 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.62 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 626 (M-1)

【0414】

実施例 5

化合物 279 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

メチル 2-アミノ-5-ブromoベンゾエート (化合物 A) (3.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.1 ml)、4-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (2.2 ml) をそれぞれ加え、同温度にて 1 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-ブromo-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエートを製造した (4.90 g, 収率 100%)。

【0415】

上記反応で得られた、メチル 5-ブromo-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (500 mg) を、無水塩化メチレン (3.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (545 μl)、4-(2-アミノエチル) モルホリン (化合物 B') (341 μl) を加え、室温で 15 時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体であるメチル 5-ブromo-2-[(3-{[(2-モルホリノエチル) アミノ] メチル} ベンゾイル) アミノ] ベンゾエートを製造した (306 mg, 収率 50%)。

【0416】

上記反応で得られた、メチル 5-プロモ-2-[(3-{[(2-モルホリノエチル)アミノ]メチル}ベンゾイル)アミノ]ベンゾエートを、エタノール(5.0 ml)に溶解させ、ヒドラジン-水和物(650 μ l)を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮し、ヒドラジン化合物 N-(4-プロモ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニル)-3-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミドを製造した(220 mg、粗収率75%)。

【0417】

N-(4-プロモ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニル)-3-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド(25 mg)を、無水トルエン(1.0 ml)に溶解させ、室温にて触媒量の酢酸、3,4-ジメチルベンズアルデヒド(化合物C)(10.0 μ l)を添加し、室温にて15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物279を製造した(21.1 mg、収率67%)。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.44 (4H, m), 2.60 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.97 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.65 (4H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 4.15 (2H, s), 7.20 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.54 (1H, m), 7.59-7.70 (3H, m), 7.76 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$), 8.30 (2H, m), 8.07 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 8.32 (1H, s), 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 594 ($M+1$)

【0418】

化合物280 N-[4-プロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)

ーメチルーアミノ]ーメチル]ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物280を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.12 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.27 (6H, s), 2.28 (3H, s), 2.60 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 2.77 (4H, q, $J=7.3\text{ Hz}$), 2.88 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.63 (2H, s), 7.16 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.50 (3H, m), 7.61 (1H, s), 7.70 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.02 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.61 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 594 ($M+1$)

【0419】

化合物281 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4-[(2-モルホリン4-イルーエチルアミノ)ーメチル]ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物281を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.43 (4H, m), 2.54 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.72 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 3.70 (4H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 3.89 (2H, s), 7.18 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.44-7.70 (6H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.31 (1H, s), 8.55 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 592 ($M+1$)

【0420】

化合物282 N-[4-ブロモ-2-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4-[(2-モルホリン4-イルーエチルアミノ)ーメチル]ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物282を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 2.39 (3H, s), 2.4

3 (4 H, m), 2.53 (2 H, t, $J=5.9$ Hz), 2.72 (2 H, t, $J=5.9$ Hz), 3.70 (4 H, t, $J=4.6$ Hz), 3.89 (2 H, s), 7.23 (2 H, d, $J=8.0$ Hz), 7.45 (2 H, d, $J=8.0$ Hz), 7.56 (1 H, m), 7.70 (3 H, m), 7.99 (2 H, m), 8.34 (1 H, s), 8.56 (1 H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 576 ($M-1$)

【0421】

化合物283 N-[4-ブromo-2-(3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物283を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 2.38 (3 H, s), 2.43 (4 H, m), 2.52 (2 H, t, $J=6.0$ Hz), 2.70 (2 H, t, $J=6.0$ Hz), 3.70 (4 H, t, $J=4.4$ Hz), 3.88 (2 H, s), 7.22-7.32 (2 H, m), 7.44 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.52 (2 H, m), 7.69 (2 H, s), 8.00 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 8.42 (2 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 578 ($M-1$)

【0422】

化合物284 N-[4-ブromo-2-(4-フルオローベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物284を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ , 2.43 (4 H, m), 2.52 (2 H, t, $J=6.0$ Hz), 2.70 (2 H, t, $J=6.0$ Hz), 3.70 (4 H, t, $J=4.5$ Hz), 3.89 (2 H, s), 7.12 (2 H, m), 7.45 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.54 (1 H, m), 7.67 (1 H, m), 7.82 (2 H, m), 8.00 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 8.39 (1 H, s), 8.48 (1 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

【0423】

化合物285 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物285を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.21 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.51-2.66 (8H, m), 3.55 (2H, s), 7.18 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.43 (3H, m), 7.66 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.74 (1H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.49 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 576 (M-1)

【0424】

化合物286 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物286を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.23 (3H, s), 2.40 (3H, s), 2.52-2.66 (8H, m), 3.59 (2H, s), 7.24-7.33 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.56 (2H, m), 7.70 (2H, m), 8.00 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.38 (1H, s), 8.50 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

【0425】

化合物287 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物287を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 1.04 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.23 (3H, s), 2.54-2.66 (8H, m), 3.59 (2H, s), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.54 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.83 (2H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, s), 8.47 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 580 (M-1)

【0426】

化合物288 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物288を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 1.04 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.22 (3H, s), 2.52-2.66 (8H, m), 3.58 (2H, s), 7.10 (1H, m), 7.34-7.46 (4H, m), 7.55 (2H, m), 7.68 (1H, s), 7.99 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.29 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.52 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

【0427】

化合物289 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物289を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 1.04 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.23 (3H, s), 2.53-2.66 (8H, m), 3.60 (2H, s), 7.48 (3H, m), 7.58 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.67 (1H, s), 7.98-8.07 (4H, m), 8.56 (1H, m), 8.52 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 664 (M-1)

【0428】

化合物 290 N-[4-プロモ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 290 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.21 (3H, s), 2.51-2.66 (8H, m), 3.56 (2H, s), 3.80 (3H, s), 6.89 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.43 (3H, m), 7.71 (3H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8.38 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.45 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 594 (M-1)

【0429】

化合物 291 N-[4-プロモ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 291 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.03 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.21 (3H, s), 2.51-2.65 (8H, m), 3.56 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.94 (1H, m), 7.27-7.48 (6H, m), 7.75 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 8.41 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.47 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

【0430】

化合物 292 N-[4-プロモ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 292 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.05 (6H, t, $J=7.$

2 Hz), 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.57-2.73 (8H, m), 3.87 (3H, s), 7.18 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.43-7.73 (6H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.56 (1H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 576 (M-1)

【0431】

化合物293 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物293を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.05 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.39 (3H, s), 2.56-2.73 (8H, m), 3.87 (2H, s), 7.22-7.27 (2H, m), 7.44 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.57-7.71 (4H, m), 7.99 (2H, m), 8.34 (1H, s), 8.59 (1H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

【0432】

化合物294 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物294を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.03 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.39 (3H, s), 2.52-2.70 (8H, m), 3.87 (2H, s), 7.23-7.33 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.55 (2H, m), 7.70 (2H, m), 8.00 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 8.38 (1H, s), 8.51 (1H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

【0433】

化合物 295 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 295 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.05 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.55-2.72 (8H, m), 3.87 (2H, s), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.56-7.82 (4H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.55 (1H, d, $J=8.6$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

【0434】

化合物 296 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 296 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.53-2.71 (8H, m), 3.88 (2H, s), 7.13 (1H, m), 7.37-7.71 (7H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8.42 (1H, s), 8.49 (1H, d, $J=8.8$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

【0435】

化合物 297 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 297 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.05 (3H, t, $J=7.1$ Hz), 1.24 (3H, m), 2.53-2.75 (6H, m), 3.72 (2H, m), 3.87 (2H, s), 7.46 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.56 (3H, m), 7.73 (1H, m), 7.98 (3H, m), 8.

0.6 (1H, s), 8.48 (1H, d, $J=8.3$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 650 (M-1)

【0436】

化合物 298 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 298 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.05 (6H, t, $J=7.2$ Hz), 2.55-2.72 (8H, m), 3.85 (3H, s), 3.87 (2H, s), 6.93 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.44 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.58 (1H, m), 7.75 (3H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.60 (1H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

【0437】

化合物 299 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 299 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.03 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.52-2.70 (8H, m), 3.86 (3H, s), 3.87 (2H, s), 6.97 (1H, m), 7.29-7.45 (5H, m), 7.56 (1H, s), 7.73 (1H, m), 7.99 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.53 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

【0438】

化合物 300 4-(3-[ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-プロピルアミノ)-メチル-N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物300を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.73 (2H, m), 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.61 (6H, m), 2.73 (2H, t, $J=6.8\text{ Hz}$), 3.60 (4H, m), 3.89 (2H, s), 7.18 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.53 (3H, m), 7.64 (1H, s), 7.71 (1H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.98-8.05 (3H, m), 8.29 (1H, s), 8.60 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 626 ($M+1$)

【0439】

化合物301 4-({3-[ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-プロピルアミノ}-メチル)-N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物301を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.74 (2H, m), 2.63 (6H, m), 2.75 (2H, m), 3.61 (4H, m), 3.90 (2H, s), 7.17 (1H, m), 7.45 (1H, m), 7.33-7.72 (5H, m), 7.89 (2H, m), 8.09 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 8.60 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 612 ($M-1$)

【0440】

化合物302 4-({3-[ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-プロピルアミノ}-メチル)-N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物302を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.75 (2H, m), 2.63 (6H, m), 2.78 (2H, m), 3.61 (4H, m), 3.91 (2H, s), 7.54 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.66 (2H, m), 8

. 00 (3H, m), 8.11 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 8.32 (1H, s), 8.38 (1H, s), 8.58 (1H, d, $J=8.8$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 696 (M-1)

【0441】

化合物303 4- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物303を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.11 (3H, s), 1.13 (3H, s), 2.29 (6H, m), 2.45-2.65 (4H, m), 3.60-3.99 (4H, m), 7.18 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.47 (3H, m), 7.55 (1H, m), 7.64 (1H, s), 7.70 (1H, s), 8.01 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.52 (1H, d, $J=8.6$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 595 (M-1)

【0442】

化合物304 4- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物304を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.11 (6H, m), 2.34 (3H, s), 2.42-2.62 (4H, m), 3.59-3.93 (4H, m), 7.19 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.44 (3H, m), 7.68 (3H, m), 7.98 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 8.41 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 579 (M-1)

【0443】

化合物305 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-

2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 305 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 2.26 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.49 (8H, m), 3.16 (2H, s), 3.49-3.70 (10H, m), 7.15 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.40-7.52 (4H, m), 7.62 (1H, s), 7.73 (1H, s), 7.96 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.38 (1H, s), 8.49 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 673 ($M-1$)

【0444】

化合物 306 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 306 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 2.50 (8H, m), 3.15 (2H, s), 3.49-3.75 (10H, m), 7.42 (2H, m), 7.54 (2H, m), 7.71 (1H, s), 7.99 (4H, m), 8.44 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8.51 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 747 ($M-1$)

【0445】

化合物 307 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 307 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 2.48 (8H, m), 3.16 (2H, s), 3.48-3.75 (10H, m), 3.81 (3H, s), 6.89 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.39 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.50 (1H, m), 7.69-7.53 (3H, m), 7.96 (2H

, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.40 (1H, s), 8.49 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 675 ($M-1$)

【0446】

化合物308 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物308を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.47 (2H, m), 1.65 (6H, m), 1.82 (2H, m), 1.94 (2H, t, $J=11.2\text{ Hz}$), 2.24 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.55-2.68 (5H, m), 2.87 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 3.47 (2H, s), 7.13 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.36 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.43 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.50 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.59 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.96 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.43 (1H, s), 8.53 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 630 ($M-1$)

【0447】

化合物309 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物309を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.47 (2H, m), 1.59-1.73 (6H, m), 1.82 (2H, m), 1.93 (2H, m), 2.34 (3H, s), 2.57-2.69 (5H, m), 2.87 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 3.47 (2H, s), 7.19 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.36 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.51 (1H, m), 7.66 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.87 (1H, s), 7.96 (2H,

d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.45 (1H, s), 8.53 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 614 (M-1)

【0448】

化合物310 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物310を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.47 (2H, m), 1.59-1.74 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.94 (2H, m), 2.35 (3H, s), 2.59-2.75 (5H, m), 2.87 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 3.47 (2H, s), 7.19 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.26 (1H, m), 7.36 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.51 (2H, m), 7.64 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.95 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.46 (1H, s), 8.54 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 614 (M-1)

【0449】

化合物311 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物311を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.47 (2H, m), 1.60-1.75 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.93 (2H, m), 2.56-2.74 (5H, m), 2.87 (2H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 3.47 (2H, s), 7.06 (2H, t, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.36 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.50 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.74 (2H, m), 7.87-8.00 (3H, m), 8.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 620 (M-1)

【0450】

化合物 312 4-[1, 4']-ピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 312 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.47 (2H, m), 1.59-1.75 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.94 (2H, m), 2.50-2.70 (5H, m), 2.87 (2H, d, $J=11.2$ Hz), 3.48 (2H, s), 7.08 (1H, m), 7.30-7.40 (3H, m), 7.50 (3H, m), 7.87 (1H, s), 7.95 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 8.49 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 620 (M-1)

【0451】

化合物 313 4-[1, 4']-ピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 313 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.50 (2H, m), 1.60-1.80 (6H, m), 1.82-1.96 (4H, m), 2.62-2.78 (5H, m), 2.86 (2H, d, $J=11.0$ Hz), 3.46 (2H, s), 7.35 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.51 (2H, d, $J=8.6$ Hz), 7.94 (5H, m), 8.50 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.57 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 702 (M-1)

【0452】

化合物 314 4-[1, 4']-ピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 314 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.47 (2H, m), 1.59–1.75 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.94 (2H, m), 2.60–2.76 (5H, m), 2.87 (2H, d, $J=11.5\text{Hz}$), 3.46 (2H, s), 3.79 (3H, s), 6.88 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.35 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.52 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.68 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.90 (1H, s), 7.95 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.41 (1H, s), 8.55 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 632 ($M-1$)

【0453】

化合物315 4-[1, 4']ピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物315を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.47 (2H, m), 1.58–1.80 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.92 (2H, m), 2.59–2.75 (5H, m), 2.85 (2H, m), 3.45 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.91 (1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 7.20–7.40 (5H, m), 7.52 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.94 (3H, m), 8.49 (1H, s), 8.56 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 632 ($M-1$)

【0454】

化合物316 N-[4-ブロモ-2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物316を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.48–2.65 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.64 (2H, t, $J=5.2\text{Hz}$), 7.18 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$)

), 7.46 (3H, m), 7.57 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.64 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 8.56 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

【0455】

化合物 317 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 317 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 2.40 (3H, s), 2.54-2.75 (10H, m), 3.60 (2H, s), 3.68 (2H, m), 7.25 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.62 (1H, m), 7.70 (3H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.28 (1H, s), 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 576 (M-1)

【0456】

化合物 318 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 318 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 2.40 (3H, s), 2.50-2.67 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.64 (2H, t, $J=5.3\text{ Hz}$), 7.24 (1H, m), 7.32 (1H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.56 (2H, m), 7.70 (2H, m), 7.99 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.34 (1H, s), 8.53 (1H, d, $J=9.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

【0457】

化合物 319 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -4- [4- (2-ヒドロキシーエチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 319 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 2.48-2.70 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.65 (2H, t, $J=5.2\text{ Hz}$), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.53 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.82 (2H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.40 (1H, s), 8.46 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)
質量分析 (ESI-MS) 580 (M-1)

【0458】

化合物 320 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [4- (2-ヒドロキシーエチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 320 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 2.50-2.75 (10H, m), 3.60 (2H, s), 3.69 (2H, t, $J=5.2\text{ Hz}$), 7.14 (1H, m), 7.36-7.72 (7H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.39 (1H, s), 8.50 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)
質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

【0459】

化合物 321 N- [4-ブromo-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [4- (2-ヒドロキシーエチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 321 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 2.50-2.72 (10H, m), 3.60 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=5.2\text{ Hz}$), 7.15 (1H, m), 7.43-7.72 (6H, m), 7.99 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.07 (1H, s), 8.46 (1H, m)
質量分析 (ESI-MS) 664 (M-1)

【0460】

化合物322 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物322を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 2.50-2.70 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.65 (2H, t, $J=5.2\text{ Hz}$), 3.85 (3H, s), 6.94 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.44 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.59 (1H, m), 7.69-7.80 (3H, m), 7.98 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.28 (1H, s), 8.60 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 594 (M-1)

【0461】

化合物323 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物323を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 2.45-2.65 (10H, m), 3.57 (2H, s), 3.63 (2H, t, $J=5.4\text{ Hz}$), 3.86 (3H, s), 6.98 (1H, m), 7.17 (1H, m), 7.22-7.58 (5H, m), 7.71 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.38 (1H, s), 8.50 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

【0462】

化合物324 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物324を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.61 (2H, m), 1.8

6-2. 24 (4H, m), 2. 89 (3H, s), 2. 30 (3H, s), 2. 75 (2H, m), 3. 57 (2H, s), 3. 71 (1H, m), 7. 18 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7. 45 (3H, m), 7. 55 (1H, m), 7. 64 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 98 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8. 30 (1H, s), 8. 54 (1H, d, $J=9.0$ Hz)
質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

【0463】

化合物325 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物325を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1. 60 (2H, m), 1. 89 (2H, m), 2. 17 (2H, m), 2. 39 (3H, s), 2. 74 (2H, m), 3. 56 (2H, m), 3. 71 (1H, s) 7. 15-7. 27 (2H, m), 7. 44 (2H, d, $J=8.0$ Hz) 7. 56 (1H, m), 7. 69 (3H, m), 7. 98 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8. 32 (1H, s), 8. 55 (1H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 549 (M-1)

【0464】

化合物326 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物326を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1. 60 (2H, m), 1. 90 (2H, m), 2. 17 (2H, m), 2. 40 (3H, s), 2. 74 (2H, m), 3. 56 (2H, m), 3. 71 (1H, m), 7. 24-7. 34 (2H, m), 7. 45 (2H, m), 7. 58 (2H, m), 7. 70 (2H, m), 7. 98 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 8. 31 (1H, s), 8. 57 (1H, d, $J=9.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

【0465】

化合物 327 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 327 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.59 (2H, m), 1.89 (2H, m), 2.17 (2H, m), 2.74 (2H, m), 3.56 (2H, s), 3.72 (1H, m), 7.13 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.56 (1H, m), 7.66 (1H, s), 7.82 (2H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.51 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

【0466】

化合物 328 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 328 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.65 (2H, m), 1.93 (2H, m), 2.30 (2H, m), 2.80 (2H, m), 3.65 (2H, s), 3.75 (1H, m), 7.15 (1H, m), 7.26-7.69 (7H, m), 7.99 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 8.54 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

【0467】

化合物 329 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 329 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.58 (2H, m), 1.91 (2H, m), 2.38 (2H, m), 2.75 (2H, m), 3.58 (2H, s), 3.71 (1H, m), 7.16 (1H, m), 7.47 (2H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.52-7.75 (4H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 8.24 (1H, s), 8.58 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 635 (M-1)

【0468】

化合物 330 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 330 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.62 (2H, m), 1.90 (2H, m), 2.20 (2H, m), 2.75 (2H, m), 3.59 (2H, s), 3.72 (1H, m), 3.86 (3H, s), 6.95 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.62-7.80 (4H, m), 7.98 (2H, m), 8.21 (1H, s), 8.70 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

【0469】

化合物 331 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 331 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.60 (2H, m), 1.90 (2H, m), 2.17 (2H, m), 2.75 (2H, m), 2.57 (2H, s), 2.72 (1H, m), 3.87 (3H, s), 6.99 (1H, m), 7.25-7.77 (7H, m), 7.97 (2H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.63 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

【0470】

化合物332 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物332を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.25-1.76 (5H, m), 2.03 (2H, m), 2.28 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.91 (2H, m), 3.50 (2H, d, J=6.3Hz), 3.58 (2H, s), 7.17 (1H, m), 7.41-7.72 (6H, m), 7.98 (2H, d, J=8.0Hz), 8.32 (1H, s), 8.53 (1H, d, J=8.5Hz)

質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

【0471】

化合物333 N-[4-ブromo-2-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物333を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.20-1.76 (5H, m), 2.04 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.93 (2H, m), 3.50 (2H, d, J=6.4Hz), 3.60 (2H, s), 7.24 (2H, m), 7.42-7.76 (5H, m), 7.98 (2H, d, J=7.8Hz), 8.33 (1H, s), 8.58 (1H, d, J=8.8Hz)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

【0472】

化合物334 N-[4-ブromo-2-(3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物334を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.20-2.15 (7H, m)

), 2.38 (3H, s), 2.93 (2H, m), 3.40-3.65 (4H, m), 7.20-7.32 (1H, m), 7.40-7.70 (6H, m), 8.27 (1H, s), 8.65 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

【0473】

化合物335 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物335を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.20-1.40 (5H, m), 1.72 (2H, m), 2.93 (2H, m), 3.47-3.65 (4H, m), 7.12 (2H, m), 7.40-7.88 (6H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8.47 (1H, s), 8.54 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 567 (M-1)

【0474】

化合物336 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物336を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.20-1.80 (5H, m), 2.05 (2H, m), 2.93 (2H, m), 3.42-3.65 (4H, m), 7.12 (1H, m), 7.24-7.66 (6H, m), 7.82 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

【0475】

化合物337 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシ

メチルーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 337 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.20-2.22 (7H, m), 2.92 (2H, m), 3.39-3.65 (4H, m), 7.14-8.10 (9H, m), 8.32 (1H, s), 8.64 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 649 (M-1)

【0476】

化合物 338 N-[4-ブロモ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 338 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.20-1.76 (5H, m), 2.03 (2H, m), 2.91 (2H, m), 3.46-3.64 (4H, m), 3.84 (3H, s), 6.93 (2H, m), 7.41-7.80 (6H, m), 7.97 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.32 (1H, s), 8.55 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 579 (M-1)

【0477】

化合物 339 N-[4-ブロモ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 339 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.20-2.25 (7H, m), 2.95 (2H, m), 3.45-3.67 (4H, m), 3.87 (3H, s), 6.80-7.80 (8H, m), 7.95 (2H, m), 8.25 (1H, s), 8.65 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

【0478】

化合物 340 N- [4-ブromo-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [4- (2-ヒドロキシ-エチル) -ピペリジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 340 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz) : δ 1.15 (2H, m), 1.35 (3H, m), 1.61 (2H, m), 1.92 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.77 (2H, m), 3.42 (2H, m), 3.52 (2H, s), 7.24 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.48 (3H, m), 7.55 (1H, s), 7.80 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.88 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.09 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 8.38 (1H, s), 8.52 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 589 (M-1)

【0479】

実施例 6

化合物 341 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (1H- [1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って得られた化合物 271 : N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (1H- [1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド (100 mg) を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、3-クロロ-パーオキシベンゾイックアシッド (32 mg) を加え室温で 2 時間攪拌した。得られた結晶をろ過し、塩化メチレン、ヘキサンで洗浄し表題化合物 341 を製造した (76 mg、収率 70%)。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz) : δ 4.65 (2H, m), 7.29 (1H, m), 7.53 (4H, m), 7.83 (3H, m), 8.08 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 8.43 (2H, m), 8.83 (1H, s), 11.72 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 569 (M-1)

【0480】

化合物 342 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -
メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニ
ル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 342 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 1.07 (6H, m), 2.30 (12H, m), 2.56 (8H, m), 3.61 (2H, s), 7.18 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.30-7.60 (6H, m), 7.93 (1H, d, J=7.6 Hz), 8.01 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 532 (M-1)

【0481】

化合物 343 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -
メチル} -N- [4-メチル-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカ
ルボニル) -チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って表題の化合物 343 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 1.05 (6H, t, J=7.1 Hz), 2.26 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.51-2.80 (8H, m), 3.60 (2H, s), 7.21 (2H, d, J=7.6 Hz), 7.30-7.80 (6H, m), 7.93 (1H, d, J=7.6 Hz), 8.00 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0482】

化合物 344 N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデ
ン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 344 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 1.03 (6H, t, J=7.2 Hz), 2.25 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.52-2.70

(8H, m), 3.60 (2H, s), 7.35-7.60 (5H, m), 7.80 (1H, m), 7.92 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.00 (2H, d, $J=3.9\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 606 (M-1)

【0483】

化合物345 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物345を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.44 (2H, m), 1.50-2.10 (12H, m), 2.30 (10H, m), 2.57 (2H, m), 2.96 (2H, d, $J=11.7\text{ Hz}$), 3.56 (2H, s), 7.17 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.30-7.55 (6H, m), 7.92 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.99 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 570 (M-1)

【0484】

化合物346 N-[4-プロモ-2-(3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物346を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD₃OD, 400MHz): δ 9.15 (1H, s), 8.73-8.78 (1H, m), 8.54 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.26-8.42 (1H, m), 8.17 (1H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 8.06 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.77 (1H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.55-7.64 (3H, m), 7.30-7.42 (3H, m), 7.05-7.10 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 447 (M-1)

【0485】

化合物347 N-[4-プロモ-2-(3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 347 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.75–8.00 (2 H, m), 8.57 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8.28 (1 H, d, $J=7.3$ Hz), 8.05–8.08 (1 H, m), 7.92–7.95 (2 H, m), 7.78 (1 H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.57 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 7.30–7.42 (3, m), 7.05–7.10 (2 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 447 ($M-1$)

【0486】

化合物 348 N-[4-クロロ-2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 348 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 9.14–9.18 (1 H, m), 8.75 (1 H, dd, $J=4.9$ Hz, $J=1.5$ Hz), 8.59 (1 H, d, $J=8.8$ Hz), 8.39 (1 H, ddd, $J=1.4$ Hz, $J=1.4$ Hz, $J=8.0$ Hz), 8.17 (1 H, d, $J=6.8$ Hz), 7.92 (1 H, d, $J=2.4$ Hz), 7.55–7.65 (4 H, m), 7.30–7.42 (3 H, m), 7.05–7.10 (2 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 403 ($M-1$)

【0487】

化合物 349 N-[4-クロロ-2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 349 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.78 (2 H, dd, $J=1.7$ Hz, $J=4.4$ Hz), 8.62 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8.18 (1 H, dd, $J=1.4$ Hz, $J=7.6$ Hz), 7.93–7.97 (3 H, m), 7.64 (1 H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.55–7.60 (2 H, m), 7.31–7.43 (3 H, m), 7.06–7.12 (2 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 403 (M-1)

【0488】

化合物 350 N- {4-プロモ-2- [3- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 350 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.78 (2H, dd, $J=1.7\text{ Hz}$, $J=4.4\text{ Hz}$), 8.57 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.31 (1H, s), 8.08 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.95 (2H, dd, $J=1.7\text{ Hz}$, $J=4.6\text{ Hz}$), 7.81 (1H, s), 7.77-7.79 (1H, m), 7.76 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 4.11 (2H, t, $J=9.5\text{ Hz}$), 3.89 (2H, t, $J=9.3\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 481 (M-1)

【0489】

化合物 351 N- {4-クロロ-2- [3- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 351 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.78 (2H, dd, $J=1.7\text{ Hz}$, $J=4.6\text{ Hz}$), 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.31 (1H, s), 7.93-7.97 (3H, m), 7.79 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.64 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 4.11 (2H, t, $J=4.8\text{ Hz}$), 3.89 (2H, t, $J=4.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

【0490】

化合物 352 N- {4-プロモ-2- [3- (2-メトキシ-フェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 352 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 9.15 (1H, d, $J=2.$

2 Hz), 8.75 (1H, dd, $J=1.4$ Hz, $J=4.9$ Hz), 8.39 (1H, ddd, $J=1.8$ Hz, $J=1.8$ Hz, $J=7.8$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=9.2$ Hz), 8.06 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.77 (1H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.56-7.65 (2H, m), 7.30-7.40 (2H, m), 7.11 (1H, dd, $J=9.5$ Hz, $J=6.1$ Hz), 7.02 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 6.97 (1H, dd, $J=7.7$ Hz), 3.90 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 480 (M-1)

【0491】

化合物353 N- {4-ブromo-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物353を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.76-8.80 (2H, m), 8.57 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.17 (1H, d, $J=9.5$ Hz), 8.07 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.94 (2H, dd, $J=1.7$ Hz, $J=4.4$ Hz), 7.78 (1H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=8.9$ Hz), 7.59 (1H, d, $J=6.4$ Hz), 7.30-7.41 (2H, m), 6.95-7.24 (3H, m), 3.90 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 480 (M-1)

【0492】

化合物354 N- {4-クロロ-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ニコチンアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物354を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 9.16 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 8.76 (1H, dd, $J=2.1$ Hz, $J=5.3$ Hz), 8.60 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.35-8.42 (1H, m), 8.16 (1H, d, $J=9.5$ Hz), 7.92 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.58-7.65 (3H, m), 7.30-7.41 (2H, m), 7.11 (1H, dd, $J=9.5$ Hz, $J=16.1$ Hz), 7.02 (1H, d, $J=7$

. 8 Hz), 6.97 (1H, dd, J=7.6 Hz, J=7.6 Hz), 3.90 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 433 (M-1)

【0493】

化合物355 N- {4-クロロ-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物355を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.78 (2H, d, J=4.4 Hz), 8.63 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.17 (1H, d, J=9.3 Hz), 7.92-7.98 (3H, m), 7.55-7.70 (2H, m), 7.30-7.38 (2H, m), 7.07-7.17 (1H, m), 6.95-7.05 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 435 (M-1)

【0494】

化合物356 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド
塩酸塩

実施例3に記載の方法に従って、表題の化合物356を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 473 (M-1)

【0495】

化合物357 N- [4-ブromo-2- (3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (3-フルオロフェニルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物357を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.59 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.33 (1H, s), 8.05-8.08 (1H, m), 7.93 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.60-7.80 (4H, m), 7.51 (2H, d, J=8.6 Hz), 6.80-7.40 (5H, m), 4.27 (2H, s), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574 (M-1)

【0496】

化合物358 N- {2- [3- (4-ジメチルアミノ-フェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ニコチンアミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物358を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 9.17 (1H, s, $J=1.5\text{ Hz}$), 8.75 (1H, dd, $J=1.5\text{ Hz}$, $H=4.9\text{ Hz}$), 8.60 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.38-8.44 (1H, m), 8.11 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.85 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.60-7.65 (2H, m), 7.42 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.29 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.94-7.00 (1H, m), 6.80-6.88 (1H, m), 6.74 (2H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 3.00 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 412 (M-1)

【0497】

化合物359 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -アミド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物359を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.79 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.73 (1H, d, $J=5.1\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.98-8.04 (1H, m), 7.89 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.73 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 7.58-7.66 (3H, m), 7.42-7.50 (1H, m), 7.15-7.22 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

【0498】

化合物360 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -アミド

ド

実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物360を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.78 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.72 (1H, d, $J=4.9\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.01 (1H, ddd, $J=7.8\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$, $J=1.4\text{Hz}$), 7.89-7.95 (2H, m), 7.88 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.58-7.65 (2H, m), 7.19 (2H, dd, $J=8.8\text{Hz}$, $J=8.8\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 395 ($M-1$)

【0499】

化合物361 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド
実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物361を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.78 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.73 (1H, d, $J=4.6\text{Hz}$), 8.31 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.98-8.04 (1H, m), 7.88 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.72 (1H, s), 7.56-7.66 (3H, m), 7.24-7.35 (2H, m), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 391 ($M-1$)

【0500】

化合物362 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド
実施例1に記載の方法に従って、表題の化合物362を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.78 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.73 (1H, d, $J=4.9\text{Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.01 (1H, ddd, $J=8.5\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$, $J=1.7\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.75 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.57-7.64 (2H, m), 7.27 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

【0501】

化合物 363 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 363 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.77 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.73 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.00 (1H, ddd, $J=1.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.67 (1H, s), 7.53-7.64 (3H, m), 7.20 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

【0502】

化合物 364 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 364 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.79 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.71-8.75 (1H, m), 8.35-8.40 (2H, m), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.07 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.98-8.04 (1H, m), 7.90 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.70 (1H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.58-7.67 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 479 (M-1)

【0503】

化合物 366 N-{4-クロロ-2-[N'-(3,4-ジメチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 366 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 529, 531, 532 (M-1)

【0504】

実施例7

化合物367 N- {4-ブromo-2- [N' - (4-メチル-ベンジル) -ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例1に記載の方法に従って得られた化合物62: N- [4-ブromo-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド (100mg) をテトラヒドロフラン/メタノール=4/1の混合溶液 (2.0ml) に溶解させ、室温にて水素化ホウ素ナトリウム (14.0mg) を添加した。同温度にて30分攪拌し、TLCにて反応終了を確認後、蒸留水 (2.0ml) を注加した。クロロホルムを用いて分液抽出し、有機相を硫酸ナトリウムにて乾燥させた後、減圧下にて濃縮した。得られた、残渣をプレパラティブTLCにて精製し、表題の化合物367 (42.2mg) を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87-7.95 (4H, m), 7.63 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.62 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.19 (2H, dd, $J=8.8\text{Hz}$), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t, $J=5.9\text{Hz}$), 2.71 (4H, t, $J=5.9\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 496, 497, 498, 499 (M-1)

【0505】

化合物368 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N- [4-クロロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物368を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.89-7.98 (3H, m), 7.70 (1H, d, $J=9.8\text{Hz}$), 7.57-7.64 (3H, m), 7.42-

7.50 (2H, m), 7.10-7.23 (1H, m), 3.62 (2H, s), 2.99 (2H, d, $J=12.0\text{ Hz}$), 2.59 (4H, bs), 2.29-2.39 (1H, m), 2.06 (2H, t, $J=11.5\text{ Hz}$), 1.86 (2H, d, $J=11.7\text{ Hz}$), 1.55-1.68 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 574, 576 ($M-1$)

【0506】

化合物369 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物369を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.88-7.97 (5H, m), 7.56-7.64 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.15-7.22 (2H, m), 3.62 (2H, s), 3.98 (2H, d, $J=12.2\text{ Hz}$), 2.57 (4H, bs), 2.25-2.35 (1H, m), 2.05 (2H, t, $J=11.1\text{ Hz}$), 1.80-1.90 (2H, m), 1.53-1.66 (7H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 574, 576 ($M-1$)

【0507】

化合物370 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物370を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.53 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.88-7.98 (4H, m), 7.71 (1H, s), 7.57-7.65 (3H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.25-7.37 (2H, m), 3.63 (

2 H, s), 3.99 (2 H, d, $J=12.0$ Hz), 2.56 (4 H, bs), 2.39 (3 H, s), 2.25-2.37 (1 H, m), 2.06 (2 H, t, $J=11.3$ Hz), 1.80-1.90 (2 H, m), 1.55-1.64 (6 H, m), 1.40-1.49 (2 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 570, 571 (M-1)

【0508】

化合物371 3-[1, 4']-ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物371を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8.33 (1 H, s), 7.89-7.98 (3 H, m), 7.74 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.57-7.64 (2 H, m), 7.52 (1 H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.27 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 3.63 (2 H, s), 2.95-3.05 (2 H, m), 2.56 (4 H, bs), 2.39 (3 H, s), 2.25-2.35 (1 H, m), 2.00-2.10 (2 H, m), 1.80-1.90 (2 H, m), 1.59 (6 H, bs), 1.40-1.50 (2 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 570, 571 (M-1)

【0509】

化合物372 3-[1, 4']-ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物372を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8.30 (1 H, s), 7.96 (1 H, s), 7.89-7.95 (2 H, m), 7.65 (1 H, s), 7.49-7.68 (4 H, m), 7.20 (1 H, d, $J=8.0$ Hz), 3.62 (2 H, s), 2.99 (2 H, d, $J=11.5$ Hz), 2.55 (4 H, bs), 2.32 (3 H, s), 2

. 30 (3H, s), 2.25-2.30 (1H, m), 2.01-2.10 (2H, m), 1.80-1.88 (2H, m), 1.54-1.65 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 584, 585 (M-1)

【0510】

化合物 373 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 373 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 8.05 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.89-7.98 (4H, m), 7.71 (1H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.64 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.56-7.62 (1H, m), 7.53 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 3.66 (2H, s), 3.00-3.10 (6H, m), 2.09-2.18 (3H, m), 1.96-2.03 (2H, m), 1.70-1.80 (6H, m), 1.55-1.65 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 658, 660 (M-1)

【0511】

化合物 374 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 374 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.62 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.32 (1H, s), 7.87-7.98 (4H, m), 7.47-7.65 (4H, m), 7.28-7.38 (2H, m), 6.97-7.03 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.61 (3H, s), 2.97 (2H, d, $J=10.5\text{ Hz}$), 2.55 (4H, bs), 2.25-2.35 (1H, m), 1.97-2.10 (2H, m), 1.80-1.88 (2H, m)

), 1.54-1.65 (6H, m), 1.44 (2H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 586, 588 (M-1)

【0512】

化合物375 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物375を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.89-7.94 (2H, m), 7.79 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.57-7.64 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.85 (3H, s), 3.62 (2H, s), 3.99 (2H, d, $J=12.0\text{ Hz}$), 2.56 (4H, bs), 2.25-2.35 (1H, m), 2.05 (2H, t, $J=11.0\text{ Hz}$), 1.80-1.90 (2H, m), 1.55-1.65 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 586, 587 (M-1)

【0513】

化合物376 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物376を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 7.89-7.98 (4H, m), 7.62 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.59 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.32 (1H, s), 7.20-7.30 (2H, m), 6.85-6.90 (1H, m), 3.64 (2H, s), 3.02 (2H, d, $J=11.7\text{ Hz}$), 2.66 (4H, bs), 2.32 (1H, bs), 2.08 (2H, t, J

=11.4 Hz), 1.85-1.93 (2H, m), 1.52-1.68 (6H, m), 1.40-1.51 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 572, 574 (M-1)

【0514】

化合物377 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物377を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.26 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.70 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 7.62 (2H, d, $J=2.4$ Hz), 7.57-7.63 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 3.63 (2H, s), 2.99 (2H, d, $J=12.0$ Hz), 2.57 (4H, bs), 2.27-2.36 (1H, m), 2.06 (2H, t, $J=11.2$ Hz), 1.85 (2H, d, $J=12.7$ Hz), 1.52-1.67 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 572, 574, 575 (M-1)

【0515】

化合物378 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-{4-ブromo-2-[N'-(3-メトキシーベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-ベンズアミド

実施例7に記載の方法に従って、表題の化合物378を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 632, 634 (M-1)

【0516】

化合物379 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物379を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.90–8.00 (2H, m), 7.89 (1H, s), 7.70 (1H, d, $J=9.8\text{Hz}$), 7.56–7.63 (3H, m), 7.53 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$), 7.43–7.49 (1H, m), 3.67 (2H, s), 2.69–2.75 (2H, m), 2.54–2.64 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 536, 538 ($M-1$)

【0517】

化合物 380 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 380 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.94 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.87–7.93 (3H, m), 7.58–7.64 (2H, m), 7.53 (1H, dd, $J=7.4\text{Hz}$, $J=7.4\text{Hz}$), 7.19 (2H, dd, $J=8.8\text{Hz}$, $J=8.8\text{Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.68–2.74 (2H, m), 2.53–2.63 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 536, 538 ($M-1$)

【0518】

化合物 381 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 381 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.89–7.96 (2H, m), 7.71 (2H, s), 7.58–7.65 (2H, m), 7.

5.3 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.25-7.35 (2H, m), 3.67 (2H, s), 2.67-2.75 (2H, m), 2.51-2.62 (6H, m), 2.39 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.01 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 532, 534 (M-1)

【0519】

化合物382 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物382を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.73 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.58-7.63 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.26 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.68-2.74 (2H, m), 2.53-2.63 (6H, m), 2.38 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 532, 534 (M-1)

【0520】

化合物383 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物383を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.89-7.95 (2H, m), 7.66 (1H, s), 7.58-7.64 (2H, m), 7.50-7.57 (2H, m), 7.20 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.68-2.75 (2H, m), 2.54-2.63 (6H, m), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.29 (3H, s)

, 1.02 (6H, t, $J=7.3\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 546, 548 ($M-1$)

【0521】

化合物384 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物384を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.38 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.03 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.95-8.00 (2H, m), 7.92 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.68 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.57-7.64 (2H, m), 7.53 (1H, s), 3.66 (2H, s), 2.71-2.79 (2H, m), 2.54-2.66 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 620, 622 ($M-1$)

【0522】

化合物385 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物385を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.89-7.96 (2H, m), 7.49-7.63 (4H, m), 7.27-7.37 (2H, m), 6.95-7.05 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.67-2.73 (2H, m), 2.53-2.62 (6H, m), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 548, 550 ($M-1$)

【0523】

化合物386 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 386 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.79 (2H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.58-7.64 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.84 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.67-2.73 (2H, m), 2.52-2.62 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 548, 550 ($M-1$)

【0524】

化合物 387 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 387 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.61 (2H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.53 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.21-7.34 (3H, m), 6.85-6.90 (1H, ddd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=6.8\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.70-2.75 (2H, m), 2.54-2.64 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 534, 536 ($M-1$)

【0525】

化合物 388 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 388 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.70 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.61 (2H, dd, $J=1.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.53 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.68 (2H, s), 2.76 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 2.55-2.68 (6H, m), 2.29 (3H, s), 1.04 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 534, 536 ($M-1$)

【0526】

化合物 389 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 389 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 506 ($M-1$)

【0527】

化合物 390 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 390 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 506 ($M-1$)

【0528】

化合物 391 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 391 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503, 504 ($M-1$)

【0529】

化合物 392 N-[4-クロロ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジ

ノカルボニル) -フェニル] -3- (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 392 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503, 504 (M-1)

【0530】

化合物 393 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 393 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 591, 593 (M-1)

【0531】

化合物 394 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 394 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.35 (1H, s), 8.00 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.71 (1H, d, $J=9.3$ Hz), 7.58-7.67 (3H, m), 7.53 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.42-7.50 (1H, m), 7.15-7.22 (1H, m), 3.69-3.74 (4H, m), 2.62 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 481, 483 (M-1)

【0532】

化合物 395 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 395 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.$

0 Hz), 8.35 (1H, s), 7.95-8.02 (2H, m), 7.87-7.95 (3H, m), 7.63 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.62 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.52 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.19 (2H, dd, $J=8.8$ Hz, $J=8.8$ Hz), 3.69-3.75 (4H, m), 2.62 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 481, 483 (M-1)

【0533】

化合物396 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物396を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.33 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.88-7.95 (3H, m), 7.71 (1H, s), 7.60-7.65 (3H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 7.25-7.36 (2H, m), 3.68-3.74 (4H, m), 2.61 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.39 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477 (M-1)

【0534】

化合物397 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物397を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.33 (1H, s), 8.00 (1H, bs), 7.90-7.95 (2H, m), 7.74 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.60-7.65 (2H, m), 7.53 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.27 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 3.70-3.78 (4H, m), 2.

6.5 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.38 (3H, s), 2.32 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477 ($M-1$)

【0535】

化合物398 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシーエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物398を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.30 (1H, s), 8.00 (1H, bs), 7.90-7.95 (2H, m), 7.66 (1H, s), 7.59-7.65 (2H, m), 7.50-7.57 (2H, m), 7.20 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 3.76 (2H, s), 3.73 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.66 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.33 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 491 ($M-1$)

【0536】

化合物399 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシーエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物399を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.03-8.08 (1H, m), 8.00 (1H, s), 7.94 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.90 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.70 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 7.58-7.67 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 3.68-3.74 (4H, m), 2.60 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 565 ($M-1$)

【0537】

化合物400 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物400を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.58-7.64 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.48-7.54 (1H, m), 7.26-7.36 (2H, m), 6.97-7.02 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.68-3.74 (4H, m), 2.61 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 495 ($M-1$)

【0538】

化合物401 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物401を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.31 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.75-7.93 (5H, m), 7.58-7.65 (2H, m), 7.53 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.85 (3H, s), 3.67-3.74 (4H, m), 2.63 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.31 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 494 ($M-1$)

【0539】

化合物402 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物402を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.88-7.94 (3H, m), 7.62 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.31 (1H, bs), 7.23-7.28 (2H, m), 3.68-3.74 (4H, m), 2.61 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479 ($M-1$)

【0540】

化合物 403 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 403 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.89-7.94 (3H, m), 7.71 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.58-7.65 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 3.71 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.70 (2H, s), 2.61 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 481 ($M-1$)

【0541】

化合物 404 3-{[ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 404 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.67 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.34 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.94 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.90 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.74 (1H, s), 7.61-7.66 (3H, m), 7.51 (1H, dd, $J=7.7$

H z, J = 7.7 Hz), 7.25-7.37 (2H, m), 3.83 (2H, s), 3.66 (4H, t, J = 5.9 Hz), 2.71 (4H, t, J = 5.9 Hz), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507, 509 (M-1)

化合物405 3- { [ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物405を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 507, 508 (M-1)

【0542】

化合物406 3- { [ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物406を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.67 (1H, d, J = 9.0 Hz), 8.30 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.92 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.87-7.91 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.60-7.65 (2H, m), 7.47-7.58 (2H, m), 7.20 (1H, d, J = 7.8 Hz), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t, J = 5.8 Hz), 2.71 (4H, t, J = 5.8 Hz), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 521, 522 (M-1)

【0543】

化合物407 3- { [ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物407を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.66 (1H, d, J = 8.

8 Hz), 8.39 (1H, s), 8.37 (1H, s), 8.05-8.10 (2H, m), 7.95 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 7.84-7.92 (1H, m), 7.70 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.60-7.68 (2H, m), 7.48-7.53 (1H, dd, $J=7.8$ Hz, $J=7.8$ Hz), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t, $J=5.8$ Hz), 2.71 (4H, t, $J=5.8$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 595, 597 (M-1)

【0544】

化合物408 3- { [ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物408を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.33 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.89-7.96 (2H, m), 7.58-7.66 (3H, m), 7.48-7.54 (1H, m), 7.28-7.38 (2H, m), 6.97-7.04 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.66 (4H, t, $J=5.9$ Hz), 2.72 (4H, t, $J=5.9$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 523, 525 (M-1)

【0545】

化合物409 3- { [ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物409を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.80-7.94 (4H, m), 7.60-7.66 (2H, m), 7.50 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.00 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 3.90 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.66 (4H, t, $J=5.9$ Hz)

z), 2.71 (4H, t, J=5.9 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 523, 525 (M-1)

【0546】

化合物 410 3- { [ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 410 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, J=9.0 Hz), 8.29 (1H, s), 8.05 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=2.4 Hz), 7.87-7.92 (1H, m), 7.60-7.66 (2H, m), 7.50 (1H, dd, J=7.7 Hz, J=7.7 Hz), 7.33 (1H, s), 7.26 (2H, d, J=4.9 Hz), 6.85-6.92 (1H, m), 3.83 (2H, s), 3.66 (4H, t, J=5.9 Hz), 2.71 (4H, t, J=5.9 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 509 (M-1)

【0547】

化合物 411 3- { [ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル } -N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 411 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.67 (1H, d, J=9.0 Hz), 8.27 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.85-7.93 (2H, m), 7.72 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.60-7.65 (2H, m), 7.47-7.54 (1H, m), 6.85 (2H, d, J=8.6 Hz), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t, J=5.9 Hz), 2.71 (4H, t, J=5.9 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 509, 511 (M-1)

【0548】

化合物 412 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -4- { [(2-ヒドロキシーエチル) -メチル
-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 412 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.94 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.68-7.74 (1H, m), 7.58-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.43-7.50 (1H, m), 7.10-7.23 (1H, m), 3.69 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 482 ($M-1$)

【0549】

化合物 413 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシーエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 413 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.87-7.95 (3H, m), 7.63 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.19 (2H, dd, $J=8.7\text{ Hz}$, $J=8.7\text{ Hz}$), 3.69 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 481, 483 ($M-1$)

【0550】

化合物 414 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシーエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 414 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.34 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.72 (1H, s), 7.60-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.26-7.36 (2H, m), 3.69 (2H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 2.40 (3H, s), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477, 479 ($M-1$)

【0551】

化合物415 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物415を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.74 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.62 (1H, dd, $J=2.5\text{Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.27 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 3.69 (2H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 3.67 (3H, s), 2.58 (2H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 2.39 (3H, s), 2.27 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477 ($M-1$)

【0552】

化合物416 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物416を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.30 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.66 (1H, s), 7.61 (1H

, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.52-7.57 (3H, m), 7.20 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 3.69 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.27 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 491, 493 (M-1)

【0553】

化合物417 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシーエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物417を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.55 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.93-7.98 (1H, m), 7.83-7.90 (3H, m), 7.60 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.54 (1H, dd, $J=2.3\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.46 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 3.59 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 3.58 (2H, s), 2.49 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.18 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 565, 567 (M-1)

【0554】

化合物418 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシーエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物418を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.56 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.24 (1H, s), 7.82-7.90 (3H, m), 7.42-7.55 (4H, m), 7.18-7.27 (2H, m), 6.88-6.94 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.56-3.61 (4H, m), 2.50 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.18 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 495 (M-1)

【0555】

化合物419 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物419を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.56 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.21 (1H, s), 7.88 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.81 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.69 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 6.89 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.75 (3H, s), 3.59 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.59 (2H, s), 2.50 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.19 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 495 ($M-1$)

【0556】

化合物420 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物420を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.55 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.19 (1H, s), 7.88 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.82-7.85 (1H, m), 7.50-7.55 (1H, m), 7.46 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.22 (1H, s), 7.13-7.18 (2H, m), 6.75-6.82 (1H, m), 3.56-3.62 (4H, m), 2.49 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.19 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 481 ($M-1$)

【0557】

化合物421 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 421 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 479, 481 (M-1)

【0558】

化合物 422 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 422 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.55 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.26 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.84 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.78-7.83 (1H, m), 7.33-7.70 (6H, m), 7.05-7.20 (1H, m), 3.72 (2H, s), 3.57 (2H, t, $J=6.1$ Hz), 2.59 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 2.54 (3H, q, $J=7.3$ Hz), 1.02 (3H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 495 (M-1)

【0559】

化合物 423 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 423 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.54 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.26 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.77-7.85 (4H, m), 7.53 (2H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.41 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.09 (2H, dd, $J=8.8$ Hz, $J=8.8$ Hz), 3.68 (2H, s), 3.57 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.57 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 2.53 (2H, q, $J=7.1$ Hz), 1.01 (3H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 495 (M-1)

【0560】

化合物 424 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジ

ノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [エチル - (2 - ヒドロキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 424 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.56 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.24 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.83 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.78-7.82 (1H, m), 7.62 (1H, s), 7.53 (2H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.42 (2H, dd, $J=7.4\text{ Hz}$, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.15-7.26 (2H, m), 3.69 (2H, s), 3.57 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.57 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.53 (2H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.30 (3H, s), 1.01 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 491 ($M-1$), 515 ($M+23$)

【0561】

化合物 425 N - [4 - クロロ - 2 - (4 - メチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [エチル - (2 - ヒドロキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 425 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.74 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.60-7.65 (2H, m), 7.51 (2H, m), 7.26 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 3.80 (2H, s), 3.67 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.69 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.64 (2H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.38 (3H, s), 1.11 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 491 ($M-1$), 515 ($M+23$)

【0562】

化合物 426 N - [4 - クロロ - 2 - (3, 4 - ジメチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [エチル - (2 - ヒドロキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 426 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.30 (1H, s), 8.02 (1H, s), 7.89–7.94 (2H, m), 7.60–7.69 (3H, m), 7.49–7.57 (2H, m), 7.21 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 3.82 (2H, s), 3.68 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.70 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.66 (2H, q, $J=7.1$ Hz), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s), 1.12 (3H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 505 ($M-1$)

【0563】

化合物 427 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 427 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 579 ($M-1$)

【0564】

化合物 428 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 428 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.33 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 7.89 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 7.56–7.66 (3H, m), 7.50 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.29–7.37 (2H, m), 6.97–7.04 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.66 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 2.61 (2H, q, $J=7.4$ Hz), 1.10 (3H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 507 ($M-1$)

【0565】

化合物429 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物429を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.91 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.87-7.91 (1H, m), 7.80 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.59-7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.85 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.62 (2H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 1.10 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0566】

化合物430 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物430を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.89 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.60-7.66 (2H, m), 7.51 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.22-7.40 (3H, m), 3.78 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 2.62 (2H, q, $J=7.3\text{ Hz}$), 1.10 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0567】

化合物431 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒド

ラジノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [エチル - (2 - ヒドロキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 431 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 8.00 (1H, s), 7.86-7.94 (2H, m), 7.70 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.58-7.65 (2H, m), 7.50 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 3.77 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.66 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.62 (2H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 1.10 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 493 ($M-1$)

【0568】

化合物 432 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 432 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 7.92-8.00 (3H, m), 7.71 (1H, d, $J=9.5\text{ Hz}$), 7.54-7.65 (4H, m), 7.43-7.51 (1H, m), 7.15-7.23 (1H, m), 3.75 (2H, s), 3.63 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.64 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.60 (2H, q, $J=7.3\text{ Hz}$), 1.09 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 495 ($M-1$)

【0569】

化合物 433 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 433 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.96 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.87-7.94 (3H, m), 7.61 (1H, dd, $J=2.4\text{Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.19 (2H, dd, $J=8.8\text{Hz}$, $J=8.8\text{Hz}$), 3.74 (2H, s), 3.63 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 2.64 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 2.60 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 1.09 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 495 ($M-1$)

【0570】

化合物434 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物434を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.12 (1H, s), 7.60-7.65 (2H, m), 7.56 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.25-7.36 (2H, m), 3.74 (2H, s), 3.63 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 2.64 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 2.60 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 2.40 (3H, s), 1.09 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 491 ($M-1$)

【0571】

化合物435 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物435を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.89 (1H, s), 7.74 (2H

, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.61 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.27 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 3.77 (2H, s), 3.64 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.63 (2H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.38 (3H, s), 1.10 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 491 (M-1)

【0572】

化合物436 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物436を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.52-7.68 (5H, m), 7.20 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 3.77 (2H, s), 3.64 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.63 (2H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s), 1.10 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

【0573】

化合物437 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物437を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.39 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.05 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.93-7.98 (2H, m), 7.89 (1H, s), 7.70 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.63 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.56 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 3.75 (

2 H, s), 3.63 (2 H, t, $J=6.4$ Hz), 2.64 (2 H, t, $J=6.4$ Hz), 2.60 (2 H, q, $J=7.1$ Hz), 1.09 (3 H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 579 (M-1)

【0574】

化合物438 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物438を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1 H, d, $J=8.8$ Hz), 8.33 (1 H, s), 7.92-7.99 (3 H, m), 7.62 (1 H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=8.8$ Hz), 7.54-7.60 (3 H, m), 7.28-7.37 (2 H, m), 6.98-7.04 (1 H, m), 3.87 (3 H, s), 3.74 (2 H, s), 3.63 (2 H, t, $J=6.2$ Hz), 2.64 (2 H, t, $J=6.3$ Hz), 2.60 (2 H, q, $J=7.2$ Hz), 1.09 (3 H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0575】

化合物439 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物439を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8.31 (1 H, s), 7.96 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.92 (1 H, d, $J=2.4$ Hz), 7.80 (2 H, d, $J=8.8$ Hz), 7.61 (1 H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.56 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 6.99 (2 H, d, $J=8.8$ Hz), 3.85 (3 H, s), 3.74 (2 H, s), 3.63 (2 H, t, $J=6.4$ Hz), 2.65 (2 H, t, $J=6.4$ Hz), 2.60 (2 H, q, $J=7.2$ Hz)

), 1.09 (3H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0576】

化合物 440 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 440 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.29 (1H, s), 7.88-7.99 (3H, m), 7.62 (1H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.56 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.30-7.33 (1H, m), 7.23-7.27 (2H, m), 6.85-6.91 (1H, m), 3.75 (2H, s), 3.63 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 2.65 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.61 (2H, q, $J=7.1$ Hz), 1.09 (3H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0577】

化合物 441 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 441 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.27 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.91 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.70 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.61 (1H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.56 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 3.78 (2H, s), 3.64 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.68 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 2.64 (2H, q, $J=7.2$ Hz), 1.10 (3H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0578】

化合物 442 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 442 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.36 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.94 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.71 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.58-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.43-7.50 (1H, m), 7.15-7.25 (1H, m), 3.85 (2H, s), 2.60-2.67 (2H, m), 2.50-2.59 (6H, m), 1.00 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 539 ($M-1$)

【0579】

化合物 443 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 443 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.35 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.88-7.95 (3H, m), 7.62 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=8.8$ Hz), 7.55 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.19 (2H, dd, $J=8.7$ Hz, $J=8.7$ Hz), 3.85 (1H, s), 2.49-2.67 (8H, m), 1.00 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 539 ($M-1$)

【0580】

化合物 444 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物444を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.72 (1H, s), 7.60-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.25-7.36 (2H, m), 3.84 (2H, s), 2.48-2.66 (8H, m), 2.39 (3H, s), 1.00 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 535 ($M-1$)

【0581】

化合物445 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物445を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.74 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.61 (1H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.27 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 3.84 (2H, s), 2.47-2.66 (8H, m), 2.39 (3H, s), 1.00 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 535 ($M-1$)

【0582】

化合物446 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物446を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.96 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.91 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.65 (1H, s), 7.60 (1H

, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.51-7.56 (3H, m), 7.19 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 3.83 (2H, s), 2.58-2.65 (2H, m), 2.48-2.58 (6H, m), 2.31 (3H, s), 2.29 (3H, s), 0.99 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 549 ($M-1$)

【0583】

化合物 447 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 447 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.39 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.05 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.93-7.99 (3H, m), 7.70 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.63 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 3.85 (2H, s), 2.50-2.68 (8H, m), 1.00 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 623 ($M-1$)

【0584】

化合物 448 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 448 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.92-8.00 (3H, m), 7.63 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.59 (1H, s), 7.55 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.28-7.38 (2H, m), 6.98-7.03 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.84 (2H, s), 2.58-2.66 (2H, m), 2.47-2.58 (6H, m), 0.99 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

【0585】

化合物 449 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 449 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.31 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.80 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.61 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.00 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.85 (3H, s), 3.84 (2H, s), 2.49-2.67 (8H, m), 1.00 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

【0586】

化合物 450 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 450 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.62 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.31 (1H, s), 7.22-7.28 (2H, m), 6.83-6.91 (1H, m), 3.85 (2H, s), 2.57-2.66 (2H, m), 2.48-2.57 (6H, m), 1.00 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 537 (M-1)

【0587】

化合物 451 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒド

ラジノカルボニル) - フェニル] - 4 - (2 - ジエチルアミノ - エチルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物451を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 7.96 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.91 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.71 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.61 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.84 (2H, s), 2.49-2.66 (8H, m), 1.00 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 537 (M-1)

【0588】

化合物452 N- [4-クロロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3- (2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物452を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 7.93-7.99 (2H, m), 7.89 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.70 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.52-7.65 (3H, m), 7.41-7.56 (2H, m), 7.15-7.23 (1H, m), 3.88 (2H, s), 2.42-2.66 (8H, m), 0.96 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 539 (M-1)

【0589】

化合物453 N- [4-クロロ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3- (2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物453を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=8.$

8 Hz), 8.36 (1H, s), 7.85-7.99 (5H, m), 7.57-7.65 (2H, m), 7.47-7.55 (1H, m), 7.12-7.23 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.46-2.65 (8H, m), 0.96 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 539 (M-1)

【0590】

化合物454 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物454を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.34 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.89 (1H, d, $J=7.1$ Hz), 7.71 (1H, s), 7.59-7.66 (3H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.24-7.35 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.46-2.65 (8H, m), 2.39 (3H, s), 0.96 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

【0591】

化合物455 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物455を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.33 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.84-7.95 (2H, m), 7.73 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.58-7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 7.26 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 3.88 (2H, s), 2.46-2.66 (8H, m), 2.38 (3H, s), 0.96 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

【0592】

化合物456 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物456を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.87-7.94 (2H, m), 7.58-7.67 (3H, m), 7.48-7.56 (2H, m), 7.19 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 3.88 (2H, s), 2.46-2.67 (8H, m), 2.31 (3H, s), 2.29 (3H, s), 0.96 (6H, q, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 549 (M-1)

【0593】

化合物457 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物457を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.40 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.04 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.93-8.00 (2H, m), 7.89 (1H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.69 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.60-7.65 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 3.88 (2H, s), 2.58-2.67 (2H, m), 2.47-2.58 (6H, m), 0.97 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 623 (M-1)

【0594】

化合物458 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシー-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

ルメチル) -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物458を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.34 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.87-7.91 (1H, m), 7.59-7.65 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.51 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.28-7.37 (2H, m), 6.97-7.03 (1H, m), 3.87 (2H, s), 3.86 (3H, s), 2.46-2.65 (8H, m), 0.96 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 ($M-1$)

【0595】

化合物459 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物459を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.31 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.92 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.89 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.79 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.59-7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 3.88 (2H, s), 3.84 (3H, s), 2.46-2.66 (8H, m), 0.96 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 ($M-1$)

【0596】

化合物460 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物460を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 537 ($M-1$)

【0597】

化合物461 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物461を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.66 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.91 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.89 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.70 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.58-7.65 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$, $J=7.8\text{ Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 3.88 (2H, s), 2.46-2.65 (8H, m), 0.96 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 537 ($M-1$)

【0598】

化合物462 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物462を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.62 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.03 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.88-7.93 (2H, m), 7.69 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 7.58-7.65 (3H, m), 7.42-7.52 (2H, m), 7.19 (1H, ddd, $J=2.0\text{ Hz}$, $J=8.4\text{ Hz}$, $J=8.4\text{ Hz}$), 4.63 (2H, s), 4.33 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 579, 581 ($M-1$)

【0599】

化合物463 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-

1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物463を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.62 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.87-7.94 (4H, m), 7.59-7.65 (2H, m), 7.48 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.19 (2H, dd, $J=8.7\text{ Hz}$, $J=8.7\text{ Hz}$), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 579 ($M-1$)

【0600】

化合物464 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物464を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.34 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.70 (1H, s), 7.59-7.64 (3H, m), 7.49 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.25-7.36 (2H, m), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, s), 2.66 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 575 ($M-1$)

【0601】

化合物465 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物465を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.73 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.61 (2H, dd

, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.48 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.27 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.38 (3H, s), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

【0602】

化合物466 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物466を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.89-7.95 (2H, m), 7.59-7.68 (3H, m), 7.54 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.49 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.21 (1H, d), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.66 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 589, 591 (M-1)

【0603】

化合物467 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物467を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.60 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.39 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.02-8.07 (2H, m), 7.93 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.89 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.69 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.62 (2H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.49 (1H, dd, $J=7$

. 7 Hz, $J=7.7$ Hz), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 3.44 (1H, s), 2.67 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 663 ($M-1$)

【0604】

化合物468 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物468を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.34 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.94 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.91 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.60-7.66 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.49 (1H, dd, $J=7.8$ Hz, $J=7.8$ Hz), 7.28-7.38 (2H, m), 6.98-7.04 (1H, m), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 3.86 (3H, s), 3.44 (1H, s), 2.67 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 591 ($M-1$)

【0605】

化合物469 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物469を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.79 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.58-7.64 (2H, m), 7.48 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 3.84 (3H, s), 3.45 (1H, s), 2.6

7 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 591 (M-1)

【0606】

化合物 470 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 470 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.62 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.89-7.95 (2H, m), 7.55-7.65 (2H, m), 7.48 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.31 (1H, s), 7.22-7.29 (2H, m), 6.86-6.90 (1H, m), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, s), 2.67 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

【0607】

化合物 471 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 471 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.27 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.87-7.93 (2H, m), 7.69 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.57-7.63 (2H, m), 7.48 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 2.67 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

【0608】

化合物 472 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -
メチル} -N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)
-4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 472 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.68 (1H, d, $J=9.5\text{ Hz}$), 7.42-7.63 (5H, m), 7.18 (1H, dd, $J=8.4\text{ Hz}$, $J=8.4\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.78 (2H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.65 (4H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.58 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.28 (3H, s), 1.04 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 628 ($M-1$)

【0609】

化合物 473 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -
メチル} -N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)
-4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 473 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=1.9\text{ Hz}$), 7.86-7.99 (5H, m), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.18 (2H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.77 (2H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.64 (4H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.58 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.28 (3H, s), 1.04 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 628 ($M-1$)

【0610】

化合物 474 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -
メチル} -N- [4-ヨード-2- (3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカ

ルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 474 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.45 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=1.1\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.88-7.93 (2H, m), 7.69 (1H, s), 7.58-7.63 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.32 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.25 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 3.66 (2H, s), 2.67-2.73 (2H, m), 2.52-2.61 (6H, m), 2.38 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.01 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 624 ($M-1$)

【0611】

化合物 475 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [4-ヨード-2- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 475 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.89-7.94 (2H, m), 7.72 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.26 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.75 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.62 (4H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 2.57 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.37 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 624 ($M-1$)

【0612】

化合物 476 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)

ル) - 4 - ヨード - フェニル] - ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物476を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.20 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.90 (2H, dd, $J=2.0\text{Hz}$, $J=8.8\text{Hz}$), 7.58-7.66 (2H, m), 7.48-7.56 (2H, m), 7.19 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 3.66 (2H, s), 2.68-2.75 (2H, m), 2.53-2.64 (6H, m), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 638 ($M-1$)

【0613】

化合物477 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨード-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物477を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.43 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.38 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.02 (1H, d, $J=.6\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.67 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 3.66 (2H, s), 2.75 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.62 (4H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.27 (3H, s), 1.03 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 712 ($M-1$)

【0614】

化合物478 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[4-ヨード-2-(3-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物478を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.56 (1H, bs), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.22-7.36 (2H, m), 6.97-7.03 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.71 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53-2.62 (6H, m), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 640 ($M-1$)

【0615】

化合物479 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [4-ヨード-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物479を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.45 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.31 (1H, s), 8.20 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.78 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 3.84 (3H, s), 3.67 (2H, s), 2.73 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.60 (4H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 2.54-2.60 (2H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 640 ($M-1$)

【0616】

化合物480 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物480を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.29 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.30 (1H, s), 7.20-7.28 (2H, m), 6.87 (1H, ddd, $J=2.2\text{Hz}$, $J=2.2\text{Hz}$, $J=7.1\text{Hz}$), 3.66 (2H, s), 2.72 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.59 (4H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 626 ($M-1$)

【0617】

化合物481 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物481を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.45 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.27 (1H, s), 8.19 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.69 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 6.83 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 3.67 (2H, s), 2.75 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.62 (4H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 2.75-2.64 (2H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 626 ($M-1$)

【0618】

化合物482 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物482を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 7.87-7.97 (4H, m), 7.42-7.72 (4H, m), 7.14-7.23 (1H, m), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 2.60 (4H, bs), 2.30-2.40 (1H, m), 2.05 (2H, t, $J=11.2\text{ Hz}$), 1.82-1.91 (2H, m), 1.55-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 666 ($M-1$)

【0619】

化合物483 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物483を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.43 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 7.85-7.97 (5H, m), 7.58 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.51 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.18 (2H, dd, $J=8.7\text{ Hz}$, $J=8.7\text{ Hz}$), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d, $J=12.0\text{ Hz}$), 2.59 (4H, bs), 2.25-2.38 (1H, m), 2.05 (2H, t, $J=11.5\text{ Hz}$), 1.85 (2H, d, $J=12.7\text{ Hz}$), 1.54-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 666 ($M-1$)

【0620】

化合物484 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物484を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$),

8 Hz), 8.34 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=1.9$ Hz), 7.88-7.97 (3H, m), 7.68 (1H, s), 7.55-7.64 (2H, m), 7.50 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=7.7$ Hz), 7.21-7.34 (2H, m), 3.60 (2H, s), 2.97 (2H, d, $J=10.8$ Hz), 2.54 (4H, bs), 2.38 (3H, s), 2.25-2.35 (1H, m), 2.25-2.35 (1H, m), 2.03 (2H, t, $J=11.7$ Hz), 1.83 (2H, d, $J=12.4$ Hz), 1.50-1.65 (6H, m), 1.38-1.48 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 662 (M-1)

【0621】

化合物485 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物485を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.44 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.33 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 7.87-7.97 (3H, m), 7.72 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.58 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.51 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 7.26 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d, $J=11.0$ Hz), 2.55 (4H, bs), 2.37 (3H, s), 2.23-2.35 (1H, m), 2.05 (2H, t, $J=11.7$ Hz), 1.84 (2H, d, $J=12.0$ Hz), 1.53-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 662 (M-1)

【0622】

化合物486 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨード-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物486を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 8.19 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.87-7.96 (3H, m), 7.62 (1H, s), 7.57 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.51 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.15-7.22 (1H, m), 3.60 (2H, s), 2.92-3.02 (2H, m), 2.52 (4H, bs), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.20-2.33 (1H, m), 1.98-2.09 (2H, m), 1.78-2.87 (2H, m), 1.50-1.65 (6H, m), 1.38-1.48 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 676 ($M-1$)

【0623】

化合物 487 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨード-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 487 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.38-8.45 (2H, m), 8.24 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.03 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.87-7.97 (3H, m), 7.68 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.58 (1H, d, $J=6.8\text{ Hz}$), 7.51 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d, $J=10.5\text{ Hz}$), 2.59 (4H, s), 2.28-2.38 (1H, m), 2.04 (2H, t, $J=11.7\text{ Hz}$), 1.80-1.90 (2H, m), 1.55-1.65 (6H, m), 1.41-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 750 ($M-1$)

【0624】

化合物 488 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 488 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.34 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.87-7.97 (3H, m), 7.48-7.60 (3H, m), 7.27-7.36 (2H, m), 6.96-7.03 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.60 (2H, s), 2.97 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 2.55 (4H, bs), 2.23-2.33 (1H, m), 2.03 (2H, t, $J=11.6\text{Hz}$), 1.83 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 1.53-1.65 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 678 ($M-1$)

【0625】

化合物489 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物489を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.32 (1H, s), 8.18-8.22 (1H, m), 7.87-7.97 (3H, m), 7.75-7.82 (2H, m), 7.55-7.62 (1H, m), 7.45-7.55 (1H, m), 6.95-7.03 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.61 (2H, s), 2.93-3.02 (2H, m), 2.56 (4H, bs), 2.20-2.35 (1H, m), 2.00-2.10 (2H, m), 1.80-1.88 (2H, m), 1.55-1.65 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 678 ($M-1$)

【0626】

化合物490 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物490を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.43 (1H, d, $J=8.$

8 Hz), 8.29 (1H, s), 8.19-8.22 (1H, m), 7.87-7.97 (3H, m), 7.57 (1H, d, $J=7.3$ Hz), 7.47-7.53 (1H, m), 7.30 (1H, s), 7.18-7.27 (2H, m), 6.83-6.89 (1H, m), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d, $J=10.5$ Hz), 2.56 (4H, bs), 2.25-2.35 (1H, m), 2.04 (2H, t, $J=12.0$ Hz), 1.84 (2H, d, $J=12.0$ Hz), 1.53-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 664 (M-1)

【0627】

化合物491 3-[1, 4']-ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物491を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.44 (1H, dd, $J=3.7$ Hz, $J=8.8$ Hz), 8.27 (1H, s), 8.18 (1H, bs), 7.86-7.96 (3H, m), 7.65-7.72 (2H, m), 7.54-7.61 (1H, m), 7.47-7.54 (1H, m), 6.79-6.86 (2H, m), 3.59-3.64 (2H, m), 2.93-3.03 (4H, m), 2.57 (4H, bs), 2.25-2.37 (1H, m), 1.95-2.10 (2H, m), 1.80-1.90 (2H, m), 1.58 (6H, bs), 1.45 (2H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 664 (M-1)

【0628】

化合物492 N-{4-クロロ-2-[N'-(3, 4-ジメチルベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物492を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.60 (1H, d, $J=8.$

8 Hz), 7.90 (1H, s), 7.78 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.59-7.70 (2H, m), 7.45-7.55 (2H, m), 7.09-7.13 (2H, m), 7.01 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 3.96 (2H, s), 3.86 (2H, s), 3.67 (2H, t, $J=6.8$ Hz), 2.58 (2H, t, $J=6.8$ Hz), 2.16 (3H, s), 2.09 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 496, 498, 499 (M-1)

【0629】

化合物493 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例6に記載の方法に従って、表題の化合物493を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.67 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.31 (1H, s), 8.11 (1H, s), 8.04 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.94 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.73 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.67 (1H, s), 7.58-7.64 (2H, m), 7.54 (1H, d, $J=7.3$ Hz), 7.21 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 4.63 (2H, s), 4.06 (2H, t, $J=5.6$ Hz), 3.20 (2H, t, $J=5.7$ Hz), 2.32 (3H, s), 2.32 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 526, 528, 529 (M-1)

【0630】

化合物494 N-[4-プロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メチル-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物494を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.52 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.33 (1H, s), 7.93 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.65-7.74 (3H, m), 7.54 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21-7.30 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 448, 450 (M-1)

【0631】

化合物 495 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 495 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.72 (1H, s), 8.67 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.28 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.86-7.92 (2H, m), 7.66 (1H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.51-7.60 (2H, m), 7.46-7.51 (1H, m), 7.33-7.39 (1H, m), 7.03-7.10 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 439, 441 (M-1)

【0632】

化合物 496 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 496 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.70 (1H, d, $J=4.1\text{ Hz}$), 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.29 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.84-7.91 (2H, m), 7.74-7.81 (2H, m), 7.61-7.66 (1H, m), 7.44-7.50 (1H, m), 7.06 (2H, dd, $J=8.5\text{ Hz}$, $J=8.5\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 439, 441 (M-1)

【0633】

化合物 497 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 497 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.69 (1H, s), 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.29 (1H, s), 8.22 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.79-7.89 (2H, m), 7.57-7.66 (2H, m), 7.48-7.54 (1H, m), 7.41-7.46 (1H, m), 7.21-7.27 (1H, m), 7.11-7.17 (1H, m), 2.35 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 435, 437 ($M-1$)

【0634】

化合物498 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド
実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物498を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.63 (1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 8.58 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.24 (1H, s), 8.16 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.77-7.84 (2H, m), 7.52-7.62 (3H, m), 7.37-7.42 (1H, m), 7.11 (2H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 2.25 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 435, 437 ($M-1$)

【0635】

化合物499 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物499を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.69 (1H, s), 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.24 (1H, s), 8.21 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.80-7.89 (2H, m), 7.57-7.63 (2H, m), 7.42-7.47 (2H, m), 7.12 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 2.26 (3H, s), 2.21 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 449, 451 ($M-1$)

【0636】

化合物 500 ピリジン-2-カルボキシリク アシッド [4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 500 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.63 (1H, s), 8.59 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.24 (1H, s), 8.14 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.97 (1H, s), 7.92 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.78-7.84 (2H, m), 7.58 (1H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.45 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.38-7.43 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 523, 525 ($M-1$)

【0637】

化合物 501 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 501 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.52 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.99 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.71 (1H, s), 7.51-7.60 (3H, m), 7.35-7.42 (1H, m), 7.09-7.15 (1H, m), 6.95-6.99 (2H, m), 4.10 (2H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.45 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 482, 484 ($M-1$)

【0638】

化合物 502 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 502 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.53 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.25 (1H, s), 7.92 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.70-7.79 (3H, m), 7.55 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=$

2. 2 Hz), 7. 00-7. 09 (2 H, m), 6. 87-6. 94 (2 H, m), 4. 04 (2 H, q, J=7. 0 Hz), 1. 39 (3 H, t, J=7. 0 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 482, 484 (M-1)

【0639】

化合物503 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシ-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物503を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8. 56 (1 H, d, J=9. 0 Hz), 8. 31 (1 H, s), 7. 99 (2 H, d, J=8. 5 Hz), 7. 71 (2 H, s), 7. 69 (1 H, s), 7. 53-7. 59 (1 H, m), 7. 22 (2 H, d, J=8. 1 Hz), 6. 96 (2 H, d, J=8. 8 Hz), 4. 09 (2 H, q, J=7. 0 Hz), 2. 38 (3 H, s), 1. 44 (3 H, t, J=7. 0 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 478, 480 (M-1)

【0640】

化合物504 N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシ-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物504を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8. 48 (1 H, d, J=8. 5 Hz), 8. 33 (1 H, s), 7. 99 (2 H, d, J=8. 1 Hz), 7. 69 (1 H, s), 7. 63 (1 H, s), 7. 45-7. 56 (2 H, m), 7. 16 (1 H, d, J=7. 8 Hz), 6. 92-6. 98 (2 H, m), 4. 08 (2 H, q, J=6. 9 Hz), 2. 29 (3 H, s), 2. 27 (3 H, s), 1. 44 (3 H, t, J=6. 8 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 492, 494 (M-1)

【0641】

化合物505 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物505を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.65-8.76 (2H, m), 8.20-8.28 (2H, m), 7.86-7.92 (1H, m), 7.65-7.72 (1H, m), 7.50-7.61 (3H, m), 7.43-7.50 (1H, m), 7.31-7.38 (1H, m), 7.10-7.20 (1H, m), 7.02-7.10 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0642】

化合物506 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物506を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.65-8.75 (2H, m), 8.20-8.28 (2H, m), 7.88 (1H, dd, $J=1.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.74-7.83 (2H, m), 7.63-7.70 (1H, m), 7.51-7.59 (1H, m), 7.43-7.49 (1H, m), 7.09-7.19 (1H, m), 7.06 (2H, dd, $J=8.5\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

【0643】

化合物507 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物507を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.65-8.74 (2H, m), 8.23 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.20 (1H, s), 7.87 (1H, ddd, $J=1.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.63-7.69 (1H, m), 7.57-7.63 (1H, m), 7.49-7.57 (1H, m), 7.42-7.49 (2H, m), 7.07-7.15 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.24 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

【0644】

化合物 508 ピリジン-2-カルボキシリク アシッド [2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 508 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.67-8.73 (2H, m), 8.29 (1H, s), 8.23 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.96-8.05 (2H, m), 7.89 (1H, ddd, $J=1.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.70 (1H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.46-7.59 (3H, m), 7.11-7.18 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 445 ($M-1$)

【0645】

化合物 509 シクロヘキサンカルボキシリク アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 509 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.49 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.22-8.29 (1H, m), 7.48-7.68 (3H, m), 7.35-7.44 (2H, m), 7.12-7.18 (1H, m), 2.27-2.36 (1H, m), 1.97-2.04 (2H, m), 1.79-1.87 (2H, m), 1.66-1.73 (1H, m), 1.45-1.52 (1H, m), 1.21-1.38 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 444, 446 ($M-1$)

【0646】

化合物 510 イソキサゾール-5-カルボキシリク アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 510 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.59 (1H, d, $J=8.$

8 Hz), 8.39 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 8.31 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.63 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.51-7.59 (2H, m), 7.34-7.41 (1H, m), 7.07-7.13 (1H, m), 7.03 (1H, d, $J=1.7$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 429, 431 (M-1)

【0647】

化合物 511 イソキサゾール-5-カルボキシリク アシッド [4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 511 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.58 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.39 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 8.29 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=1.7$ Hz), 7.63-7.70 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.17-7.31 (2H, m), 7.03 (1H, d, $J=1.7$ Hz), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 425, 427 (M-1)

【0648】

化合物 512 イソキサゾール-5-カルボキシリク アシッド [4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 512 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.59 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.40 (1H, d, $J=1.7$ Hz), 8.26 (1H, s), 7.96 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 7.68 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=9.0$ Hz), 7.63 (1H, s), 7.51 (1H, d, $J=7.3$ Hz), 7.18 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.05 (1H, d, $J=1.7$ Hz), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 439, 441 (M-1)

【0649】

化合物 513 イソキサゾール-5-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 513 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.60 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.42 (1H, d, $J=1.7$ Hz), 8.35 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.04 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.97-8.01 (1H, m), 7.70 (1H, dd, $J=2.3$ Hz, $J=8.9$ Hz), 7.58 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.06 (1H, d, $J=1.7$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 513, 515 ($M-1$)

【0650】

化合物 514 2, 5-ジメチル-フラン-3-カルボキシリック アシッド [2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 514 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.56 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.27 (1H, s), 7.46-7.68 (4H, m), 7.35-7.42 (1H, m), 7.04-7.14 (2H, m), 6.39 (1H, s), 2.62 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 378 ($M-1$)

【0651】

化合物 515 2, 5-ジメチル-フラン-3-カルボキシリック アシッド [2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 515 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.54 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 8.27 (1H, s), 7.76-7.85 (2H, m), 7.61 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.48 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.

0.1-7.16 (3H, m), 6.38 (1H, s), 2.62 (3H, s),
2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

【0652】

化合物516 2, 5-ジメチル-フラン-3-カルボキシリック アシッド
[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ア
ミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物516を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.56 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.27 (1H, s), 7.67-7.74 (1H, m), 7.40-7.60 (4H, m), 7.28-7.35 (1H, m), 6.96-7.04 (1H, m), 6.38 (1H, s), 2.64 (3H, s), 2.40 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

【0653】

化合物517 N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物517を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.15 (1H, s), 7.62-7.69 (2H, m), 7.58 (1H, d, $J=9.3$ Hz), 7.52 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.37-7.44 (1H, m), 7.10-7.17 (1H, m), 6.93 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 6.53 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.60 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

【0654】

化合物518 3, 4-ジメトキシ-N-[4-メチル-3-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物518を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.10 (1H, s), 7.63-7.72 (3H, m), 7.54 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.24-7.35 (2H, m), 6.92 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.53 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

【0655】

化合物519 3, 4-ジメトキシ-N-[4-メチル-3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物519を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.10 (1H, s), 7.63-7.73 (4H, m), 7.22-7.28 (2H, m), 6.92 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.54 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

【0656】

化合物521 N-[3-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物521を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.07 (1H, s), 7.63-7.70 (3H, m), 7.47 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.19 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.92 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 6.54 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s), 2.31 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

【0657】

化合物522 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデ

ン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフエン-2-イル] - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 522 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 8.23 (1H, s), 8.05-8.08 (1H, m), 7.93-7.98 (1H, m), 7.62-7.68 (2H, m), 7.58 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 6.92-7.68 (2H, m), 7.58 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 6.92-6.97 (1H, m), 6.55 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

【0658】

化合物 523 N-[2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフエン-3-イル] - 3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 523 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

【0659】

化合物 524 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフエン-3-イル] - 3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 524 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0660】

化合物 525 N-[2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフエン-3-イル] - 3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 525 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

【0661】

化合物 526 3- (3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル) -N- [4-メチル-2- (4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 526 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

【0662】

化合物 527 N- [2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -3- (3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 527 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

【0663】

化合物 528 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 528 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0664】

化合物 529 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 529 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0665】

化合物 530 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 530 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1)

【0666】

化合物 531 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 531 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 572 (M-1)

【0667】

化合物 532 N-[2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 532 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 532 (M-1)

【0668】

化合物 533 3-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[4-メチル-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 533 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0669】

化合物 534 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 534 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0670】

化合物 535 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 535 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0671】

化合物536 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物536を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0672】

化合物537 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物537を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

【0673】

化合物538 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物538を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

【0674】

化合物539 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-3-イル]-3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物539を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

【0675】

化合物540 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 540 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 521 (M-1)

【0676】

化合物 541 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-(4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 541 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

【0677】

化合物 542 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-(4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 542 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0678】

化合物 543 3-(4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 543 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

【0679】

化合物 544 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド {4-ブロモ-2-[N'-(4-メチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-アミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 544 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

【0680】

化合物 545 N-{2-[N'-(4-メチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-イソニコチンアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 545 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 359 (M-1)

【0681】

化合物 546 N- {4-ブromo-2- [N' - (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジル) -ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3- (2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 546 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 614, 616, 617 (M-1)

【0682】

化合物 547 N- {4-クロロ-2- [N' - (4-メチル-ベンジル) -ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3- (2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 547 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 483 (M-1)

【0683】

化合物 548 N- {4-ブromo-2- [N' - (3, 4-ジメチル-ベンジル) -ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3, 4-ジメトキシーベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 548 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 508, 510 (M-1)

【0684】

化合物 549 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル } -N- [4-クロロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 549 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.35 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.93-7.96 (1H, m), 7.85-7.96 (1H, m), 7.85-7.92 (1H, m), 7.71-7.76 (1H, m), 7.58-7.65 (3H, m), 7.40-7.54 (2H, m), 7.15-7.23 (1H, m), 3.83 (

2 H, s), 3.61-3.67 (4 H, m), 2.67-2.74 (4 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 511, 513 (M-1)

【0685】

化合物 550 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル } -N- [4-クロロ-2- (4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 550 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.66 (1 H, d, $J=8.8$ Hz), 8.35 (1 H, s), 8.06 (1 H, s), 7.87-7.95 (4 H, m), 7.63 (1 H, d, $J=8.8$ Hz), 7.62 (1 H, d, $J=8.8$ Hz), 7.50 (1 H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 7.19 (2 H, dd, $J=8.8$ Hz), 3.83 (2 H, s), 3.65 (4 H, t, $J=5.9$ Hz), 2.71 (4 H, t, $J=5.9$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 511, 513 (M-1)

【0686】

実施例 8

化合物 551 N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -3- (1H- [1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート (化合物 A) (3.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン (1.5 ml)、3- (クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (2.8 ml) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ-4-メチル-チオフェン-3-カルボキリックアシッドエチルエステル) を製造した (3.80 g, 収率 70%)。

【0687】

上記反応で得られた、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ-4-メチル-チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル (700 mg) を、無水塩化メチレン (5.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (580 μ l)、3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール (化合物 B') (404 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である4-メチル-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを製造した (606 mg、収率72%)。

【0688】

上記反応で得られた、4-メチル-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを、エタノール (5.0 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (650 μ l) を加え、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮し、ヒドラジン化合物 N-(3-ヒドラジノカルボニル-4-メチル-チオフェン-2-イル)-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミドを製造した (103 mg、粗収率20%)。

【0689】

N-(3-ヒドラジノカルボニル-4-メチル-チオフェン-2-イル)-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド (20 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物 C) (13.0 μ l) を添加し、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物 551 を製造した (1

7. 4 mg、収率 69%)。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz) : δ 2.25 (6H, s), 2.37 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.79 (1H, s), 7.15–8.00 (7H, m), 8.28 (1H, s), 8.56 (1H, s), 11.20–11.70 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

【0690】

化合物 552 N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 552 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz) : δ 2.34 (3H, s), 2.37 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.80 (1H, s), 7.20–8.00 (8H, m), 8.30 (1H, m), 8.57 (1H, s), 11.30–11.70 (2H, m), 14.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 489 (M-1)

【0691】

化合物 553 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 553 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz) : δ 2.36 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.81 (1H, s), 7.25–8.00 (8H, m), 8.40 (1H, m), 8.57 (1H, s), 11.30–11.70 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0692】

化合物 554 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリ

アゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物554を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , 400MHz): δ 2.35 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.81 (1H, s), 7.20-7.96 (8H, m), 8.36 (1H, s), 8.56 (1H, s), 11.40-11.75 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0693】

化合物555 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物555を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , 400MHz): δ 2.34 (3H, s), 4.38 (2H, s), 6.82 (1H, s), 7.40-8.58 (9H, m), 11.40-11.75 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

【0694】

化合物556 N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物556を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , 400MHz): δ 2.37 (3H, s), 3.80 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.80 (1H, s), 7.01 (2H, m), 7.40-7.74 (6H, m), 8.35 (1H, s), 8.57 (1H, s), 11.20-11.75 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

【0695】

化合物 557 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 557 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.77 (2H, m), 2.31 (6H, m), 2.50 (5H, m), 3.63 (2H, m), 3.82 (2H, s), 6.70 (1H, s), 7.19 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.45-7.67 (4H, m), 7.80-7.95 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

【0696】

化合物 558 3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-N-[4-メチル-3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 558 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.77 (2H, m), 2.38 (3H, s), 2.50 (5H, m), 3.60 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 3.82 (2H, s), 6.71 (1H, d, $J=0.96\text{ Hz}$), 7.26 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.50 (1H, m), 7.60 (1H, m), 7.73 (2H, m), 7.84 (1H, m), 7.92 (1H, s), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

【0697】

化合物 559 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 559 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.77 (2H, m), 2.50 (5H, m), 3.62 (2H, m), 3.82 (2H, s), 6.71 (1

H, s), 7.12 (2H, m) 7.50 (1H, m), 7.60 (1H, m), 7.87 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

【0698】

化合物560 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-(3-ヒドロキープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物560を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.77 (2H, m), 2.51 (5H, m), 3.60 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 3.82 (2H, s), 6.72 (1H, s), 7.18 (1H, m), 7.42-7.65 (5H, m), 7.84 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

【0699】

化合物561 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-(3-ヒドロキープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物561を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.77 (2H, m), 2.50 (5H, m), 3.60 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.82 (2H, s), 6.72 (1H, s), 7.50 (1H, m), 7.61 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.68 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.84 (1H, m), 7.93 (1H, s), 8.05 (1H, m), 8.33 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

【0700】

化合物562 3-(3-ヒドロキープロピルスルファニルメチル)-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物562を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.77 (2H, m), 2.50 (5H, m), 3.60 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 3.81 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.70 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.50 (1H, m), 7.60 (1H, m), 7.80 (3H, m), 7.92 (1H, s), 8.23 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

【0701】

化合物563 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物563を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.05 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.26 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.50 (2H, m), 2.57 (2H, m), 2.67 (5H, m), 2.79 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.64 (1H, s), 7.19 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.46-7.65 (4H, m), 7.86-7.97 (2H, m), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 532 (M-1)

【0702】

化合物564 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフエン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物564を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.05 (6H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.26 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.50 (2H, s), 2.57 (2H, m), 2.67 (5H, m), 2.78 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.63 (1H, s), 7.25 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.51 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.58 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.72 (2H, m), 7.91 (2H, m)

, 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0703】

化合物565 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物565を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.05 (6H, m), 2.56 (3H, s), 2.49 (2H, m), 2.57 (2H, m), 2.66 (5H, m), 2.77 (2H, m), 3.64 (2H, s), 6.62 (1H, s), 7.16 (2H, dd, $J=8.7\text{Hz}$, $J=8.7\text{Hz}$), 7.50 (2H, m), 7.91 (4H, m), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0704】

化合物566 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物566を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.07 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.26 (3H, m), 2.50 (2H, s), 2.58 (2H, m), 2.72 (5H, m), 2.83 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.62 (1H, s), 7.15 (1H, ddd, $J=8.3\text{Hz}$, $J=8.3\text{Hz}$, $J=1.7\text{Hz}$), 7.40-7.80 (5H, m), 7.87-7.90 (2H, m), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0705】

化合物567 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-2-イル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 567 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.06 (6H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.26 (3H, m), 2.49 (2H, s), 2.57 (2H, m), 2.68 (5H, m), 2.80 (2H, m), 3.64 (2H, s), 6.60 (1H, s), 7.50 (1H, m), 7.57 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.65 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.94 (3H, m), 8.28 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 606 ($M-1$)

【0706】

化合物 568 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 568 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.05 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.25 (3H, s), 2.49 (2H, s), 2.57 (2H, m), 2.66 (5H, m), 2.77 (2H, m), 3.64 (2H, m), 3.83 (3H, s), 6.63 (1H, s), 6.97 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.42-7.59 (2H, m), 7.76 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 534 ($M-1$)

【0707】

化合物 569 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチルーN- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 569 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.49 (2H, m), 1.64 (6H, m), 1.87 (2H, m), 2.03 (2H, m), 2.27 (1H, m), 2.29 (6H, m), 2.49 (3H, s), 2.71 (4H, m), 2.96 (2H, d, $J=11.0\text{Hz}$), 3.59 (2H, s), 6.66

(1H, s), 7.18 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.45-7.73 (4H, m), 7.88 (2H, s), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 570 (M-1)

【0708】

化合物570 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物570を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.49 (2H, m), 1.65 (6H, m) 1.88 (2H, d, $J=11.0$ Hz), 2.04 (2H, t, $J=11.5$ Hz), 2.34 (1H, s), 2.37 (3H, s), 2.49 (3H, s), 2.74 (4H, bs), 2.97 (2H, d, $J=11.2$ Hz), 3.58 (2H, s), 6.67 (1H, s), 7.24 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.45-7.60 (2H, m), 7.70 (2H, m), 7.85-7.95 (2H, m), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 556 (M-1)

【0709】

化合物571 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物571を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.48 (2H, m), 1.63 (6H, m) 1.86 (2H, d, $J=11.4$ Hz), 2.03 (2H, t, $J=11.2$ Hz), 2.36-2.54 (4H, m), 2.66 (4H, m), 2.96 (2H, d, $J=11.2$ Hz), 3.58 (2H, s), 6.66 (1H, s), 7.17 (2H, dd, $J=8.5$ Hz, $J=8.5$ Hz), 7.45-7.60 (2H, m), 7.85-7.94 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

【0710】

化合物572 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物572を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.49 (2H, m), 1.64 (6H, m), 1.87 (2H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 2.03 (2H, t, $J=11.2\text{Hz}$), 2.49 (4H, s), 2.72 (4H, m), 2.96 (2H, d, $J=11.5\text{Hz}$), 3.58 (2H, s), 6.65 (1H, s), 7.15 (1H, m), 7.40-7.75 (5H, m), 7.85-7.95 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

【0711】

化合物573 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物573を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.49 (2H, m), 1.63 (6H, m), 1.87 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 2.04 (2H, t, $J=11.1\text{Hz}$), 2.40-2.54 (4H, m), 2.68 (4H, m), 2.97 (2H, d, $J=11.5\text{Hz}$), 3.59 (2H, s), 6.65 (1H, s), 7.45-7.60 (2H, m), 7.67 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.85-8.05 (3H, m), 8.31 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 644 (M-1)

【0712】

化合物574 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物574を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.49 (2H, m), 1.61 (6H, m) 1.85 (2H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 2.02 (2H, t, $J=11.6\text{Hz}$), 2.30-2.52 (4H, m), 2.65 (4H, bs), 2.95 (2H, d, $J=11.0\text{Hz}$), 3.58 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.66 (1H, s), 6.98 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.44-7.61 (2H, m), 7.76 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 572 ($M-1$)

【0713】

化合物575 N-[3-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルーチオフエン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物575を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.29 (6H, s), 2.48 (3H, s), 2.52-2.70 (10H, m), 3.62 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 6.68 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 7.17 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.50 (2H, m), 7.59 (2H, m), 7.80-7.95 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 532 ($M-1$)

【0714】

化合物576 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[4-メチルー3-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物576を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.38 (3H, s), 2.49 (3H, s), 2.54-2.74 (10H, m), 3.60-3.70 (4H, m), 6.71 (1H, d, $J=1.2\text{Hz}$), 7.25 (2H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.51 (1H, dd, $J=7.4\text{Hz}$, $J=7.4\text{Hz}$), 7.59 (1H, d, $J=7.4\text{Hz}$), 7.71 (2H, bs), 7.85-7

. 95 (2H, m), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0715】

化合物577 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物577を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 2.49 (3H, m), 2.52-2.76 (10H, m), 3.63 (2H, s), 3.68 (2H, t, $J=5.8\text{Hz}$), 6.69 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 7.17 (2H, dd, $J=8.6\text{Hz}$, $J=8.6\text{Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.82-7.94 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0716】

化合物578 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物578を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 2.49 (3H, s), 2.57 (4H, m), 2.64 (2H, t, $J=5.9\text{Hz}$), 2.71 (4H, m), 3.63 (2H, s), 3.68 (2H, t, $J=5.9\text{Hz}$), 6.68 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 7.16 (1H, dd, $J=8.1\text{Hz}$, $J=8.1\text{Hz}$), 7.40-7.70 (5H, m), 7.82-7.95 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

【0717】

化合物579 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-[4

— (2-ヒドロキシエチル) —ピペラジン—1—イルメチル] —ベンズアミド
(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物579を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.49 (3H, s), 2.52–2.68 (10H, m), 3.63 (2H, s), 3.66 (2H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 6.70 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$, $J=7.3\text{Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.67 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.87 (1H, m), 7.93 (1H, s), 8.00 (1H, bs), 8.32 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 606 ($M-1$)

【0718】

化合物580 3- [4- (2-ヒドロキシエチル) —ピペラジン—1—イルメチル] —N- [3- (4-メトキシベンジリデン—ヒドラジノカルボニル) —4-メチルーチオフエン—2—イル] —ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物580を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.49 (3H, s), 2.50–2.75 (10H, m), 3.63 (2H, s), 3.67 (2H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 3.83 (3H, s), 6.69 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 6.98 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.76 (2H, m), 7.82–7.94 (2H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 534 ($M-1$)

【0719】

化合物581 3- [(2-ジエチルアミノ—エチルアミノ) —メチル] —N- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン—ヒドラジノカルボニル) —4-メチルーチオフエン—2—イル] —ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物581を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.20 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.51 (3H, s), 2.91 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 3.02 (6H, m), 3.97

(2H, s), 6.71 (1H, d, $J=1.0$ Hz), 7.20 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.50-7.70 (4H, m), 7.91 (1H, m), 7.99 (1H, m), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0720】

化合物582 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[4-メチル-3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物582を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.22 (6H, t, $J=7.2$ Hz), 2.39 (3H, s), 2.51 (3H, s), 2.93 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 3.06 (6H, m), 3.39 (2H, s), 6.72 (1H, d, $J=1.0$ Hz), 7.27 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.52-7.77 (4H, m), 7.91 (1H, m), 8.01 (1H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

【0721】

化合物583 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物583を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.19 (6H, t, $J=7.2$ Hz), 2.52 (3H, s), 2.89 (2H, t, $J=6.1$ Hz), 2.98 (6H, m), 3.96 (2H, s), 6.72 (1H, d, $J=1.0$ Hz), 7.19 (2H, dd, $J=8.7$ Hz, $J=8.7$ Hz), 7.56 (1H, m), 7.64 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.90 (3H, m), 7.99 (1H, s), 8.30 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 509 (M-1)

【0722】

化合物 584 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド (実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 584 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.20 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.52 (3H, s), 2.90 (2H, m), 3.00 (6H, m), 3.96 (2H, s), 6.71 (1H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 7.18 (1H, dd, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.46 (1H, m), 7.52-7.75 (4H, m), 7.91 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.31 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 508 ($M-1$)

【0723】

化合物 585 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 585 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.16 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.51 (3H, s), 2.91 (8H, m), 3.95 (2H, s), 6.70 (1H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 7.55 (1H, m), 7.64 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.69 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.91 (1H, m), 7.98 (2H, m), 8.34 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 592 ($M-1$)

【0724】

化合物 586 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 586 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.16 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.51 (3H, s), 2.90 (8H, m), 3.85 (3H, s)

), 3.94 (2H, s), 6.70 (1H, d, $J=1.0$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.56 (1H, m), 7.64 (1H, m), 7.79 (2H, d, $J=7.3$ Hz), 7.91 (1H, m), 7.98 (1H, s), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520 (M-1)

【0725】

化合物 587 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 587 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.09 (6H, m), 2.31 (6H, m), 2.51 (7H, m), 3.60-3.95 (4H, m), 6.70 (1H, d, $J=1.0$ Hz), 7.19 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.52 (2H, m), 7.65 (2H, d, $J=6.6$ Hz), 7.87 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

【0726】

化合物 588 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 588 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.09 (6H, m), 2.38 (3H, s), 2.51 (7H, m), 3.68-3.94 (4H, m), 6.70 (1H, d, $J=1.2$ Hz), 7.25 (2H, m), 7.51 (1H, m), 7.65 (1H, d, $J=7.3$ Hz), 7.73 (2H, m), 7.87 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 521 (M-1)

【0727】

化合物 589 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}

ル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 589 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.09 (6H, m), 2.49 (7H, m), 3.65-3.95 (4H, m), 6.71 (1H, m), 7.18 (2H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.51 (1H, dd, $J=7.4\text{ Hz}$, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.65 (1H, d, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.88 (3H, m), 7.99 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 526 ($M-1$)

【0728】

化合物 590 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 590 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.09 (6H, m), 2.49 (7H, m), 3.87 (4H, m), 6.71 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.17 (2H, m), 7.40-7.75 (4H, m), 7.87 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.00 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 525 ($M-1$)

【0729】

化合物 591 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 591 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.08 (6H, m), 2.50 (7H, m), 3.65-3.95 (4H, m), 6.71 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.51 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.66 (2H, m), 7.86 (1H, m), 8.02 (2H, m), 8.33 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 609 (M-1)

【0730】

化合物592 3-[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物592を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.09 (6H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.49 (7H, m), 3.85 (7H, m), 6.70 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 6.99 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.51 (1H, m), 7.65 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.84 (3H, m), 7.99 (1H, s), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 537 (M-1)

【0731】

化合物593 N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物593を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.59 (2H, m), 1.85 (2H, m), 2.29 (8H, bs), 2.48 (3H, s), 2.84 (2H, m), 3.66 (3H, m), 6.68 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.17 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.52 (1H, m), 7.61 (2H, d, $J=5.6\text{ Hz}$), 7.89 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

【0732】

化合物594 3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物594を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.59 (2H, m), 1.8

6 (2H, m), 2.35 (5H, m), 2.49 (3H, s), 2.87 (2H, m), 3.67 (3H, m), 6.70 (1H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 7.25 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.53 (1H, dd, $J=7.3\text{ Hz}$, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.63 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.71 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 489 (M-1)

【0733】

化合物595 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物595を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.62 (2H, m), 1.87 (2H, m), 2.36 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.89 (2H, m), 3.66 (1H, m), 3.74 (2H, s), 6.72 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.18 (2H, dd, $J=8.6\text{ Hz}$, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.54 (1H, m), 7.64 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.91 (4H, m), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0734】

化合物596 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物596を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): 1.60 (2H, m), 1.87 (2H, m), 2.35 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.88 (2H, m), 3.66 (1H, m), 3.72 (2H, s), 6.69 (1H, d, $J=1.1\text{ Hz}$), 7.16 (1H, dd, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.44 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.63 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

【0735】

化合物 597 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 597 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.61 (2H, m), 1.86 (2H, m), 2.37 (2H, m), 2.50 (3H, s), 2.90 (2H, m), 3.67 (1H, m), 3.74 (2H, s), 6.72 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.55 (1H, dd, $J=7.5\text{ Hz}$, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.66 (2H, m), 7.92 (3H, m), 8.33 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

【0736】

化合物 598 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 598 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 1.61 (2H, m), 1.87 (2H, m), 2.37 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.89 (2H, m), 3.66 (1H, m), 3.73 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.69 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 6.97 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.53 (1H, m), 7.62 (1H, m), 7.76 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

【0737】

化合物 599 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 599 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.29 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 2.19 (2H, m), 2.30 (6H, s), 2.49 (3H, s), 2.99 (2H, d, $J=10.8\text{ Hz}$), 3.38 (2H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 3.73 (2H, s), 6.70 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.19 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.54 (2H, m), 7.62 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 517 (M-1)

【0738】

化合物600 3-(4-ヒドロキシメチルーピペリジーン-1-イルメチル)-N-[4-メチルー3-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物600を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.30 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d, $J=13.2\text{ Hz}$), 2.22 (2H, t, $J=11.5\text{ Hz}$), 2.37 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.00 (2H, d, $J=11.0\text{ Hz}$), 3.38 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.74 (2H, s), 6.68 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.24 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.4\text{ Hz}$, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.62 (1H, d, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.69 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

【0739】

化合物601 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルーチオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチルーピペリジーン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物601を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.30 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d, $J=12.2\text{ Hz}$), 2.22 (2H,

t, $J=11.4\text{ Hz}$), 2.48 (3H, s), 3.01 (2H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 3.38 (2H, d, $J=6.4\text{ Hz}$), 3.73 (2H, s), 6.68 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.16 (2H, dd, $J=8.6\text{ Hz}$, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.62 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.88 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0740】

化合物602 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチルペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物602を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.31 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.76 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 2.23 (2H, d, $J=10.8\text{ Hz}$), 2.45 (3H, s), 3.02 (2H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 3.39 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.75 (2H, s), 6.69 (1H, d, $J=1.0\text{ Hz}$), 7.17 (1H, m), 7.44 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.63 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0741】

化合物603 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチルペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物603を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.31 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.76 (2H, d, $J=11.7\text{ Hz}$), 2.21 (2H, t, $J=11.5\text{ Hz}$), 2.49 (3H, s), 3.01 (2H, d, $J=11.5\text{ Hz}$), 3.38 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.74 (2H, s)

, 6.70 (1H, s), 7.54 (1H, dd, $J=7.4$ Hz), 7.65 (2H, m), 7.94 (3H, m), 8.31 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 591 (M-1)

【0742】

化合物604 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物604を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.29 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d, $J=12.2$ Hz), 2.20 (2H, t, $J=11.1$ Hz), 2.47 (3H, s), 3.00 (2H, d, $J=10.8$ Hz), 3.38 (2H, d, $J=6.4$ Hz), 3.72 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.67 (1H, s), 6.96 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.51 (1H, dd, $J=7.4$ Hz), 7.61 (1H, d, $J=7.4$ Hz), 7.75 (2H, d, $J=6.4$ Hz), 7.89 (2H, m), 8.23 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 519 (M-1)

【0743】

化合物605 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフエン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物605を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.77 (2H, m), 1.89 (4H, m), 2.30 (6H, s), 2.51 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.74 (2H, m), 2.85 (2H, m), 3.60 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 3.82 (2H, s), 7.19 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.51 (2H, m), 7.61 (2H, m), 7.87 (2H, m), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1)

【0744】

化合物 606 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 606 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.77 (2H, m), 1.89 (4H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 2.75 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 3.82 (2H, s), 7.18 (2H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.87 (2H, m), 8.06 (2H, m), 8.27 (1H, s).

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

【0745】

化合物 607 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 607 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.77 (2H, m), 1.90 (4H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 2.77 (2H, m), 2.86 (2H, bs), 3.63 (2H, m), 3.82 (2H, s), 7.17 (1H, dd, $J=8.0\text{ Hz}$, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.55 (5H, m), 7.84 (1H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.92 (1H, s), 8.27 (1H, s).

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

【0746】

化合物 608 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)

ーベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物608を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.77 (2H, m), 1.90 (4H, m), 2.51 (2H, m), 2.76 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (2H, m), 3.83 (2H, s), 7.52 (1H, m), 7.62 (1H, m), 7.68 (1H, m), 7.75–8.08 (4H, m), 8.32 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 608 (M-1)

【0747】

化合物609 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物609を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.08 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.85 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.29 (6H, s), 2.75 (12H, m), 3.62 (2H, s), 7.17 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.44 (2H, dd, $J=15.0\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.63 (2H, s), 7.95 (2H, m), 8.06 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 572 (M-1)

【0748】

化合物610 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物610を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.08 (6H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1.85 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.37 (3H, s)

), 2.74 (12H, m), 3.61 (2H, s), 7.20 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.44 (1H, dd, $J=15.9\text{ Hz}$, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.54 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.66 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.95 (2H, m), 8.12 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 558 (M-1)

【0749】

化合物611 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物611を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.10 (6H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 1.83 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.75 (12H, m), 3.61 (2H, s), 7.09 (2H, dd, $J=8.6\text{ Hz}$, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.44 (1H, dd, $J=15.1\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.54 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.76 (2H, m), 7.93 (2H, m), 8.16 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

【0750】

化合物612 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物612を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.11 (6H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 1.81 (4H, m), 2.23 (3H, s), 2.77 (12H, m), 3.61 (2H, s), 7.08 (1H, m), 7.31-7.59 (4H, m), 7.91 (2H, m), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

【0751】

化合物 613 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 613 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.10 (6H, m), 1.91 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.55-2.80 (12H, m), 3.63 (2H, s), 7.46 (1H, m), 7.57 (2H, d, 8.3 Hz), 7.94 (3H, m), 8.04 (1H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 646 (M-1)

【0752】

化合物 614 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 614 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.04 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.83 (4H, m), 2.23 (3H, s), 2.68 (12H, m), 3.60 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.89 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.45 (1H, dd, J=15.4 Hz, J=7.6 Hz), 7.56 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.82-8.02 (2H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574 (M-1)

【0753】

化合物 615 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物615を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.46 (2H, bs), 1.68–2.06 (15H, m), 2.27 (6H, s), 2.60–3.02 (10H, m), 3.54 (2H, s), 7.14 (1H, m), 7.46 (3H, m), 7.60 (1H, s), 7.94 (2H, m), 8.11 (1H, s)
質量分析 (ESI-MS) 610 (M-1)

【0754】

化合物616 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物616を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.47 (2H, bs), 1.68–2.08 (14H, m), 2.37 (3H, s), 2.65–3.00 (11H, m), 3.54 (2H, s), 7.20 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.45 (2H, m), 7.66 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.90 (2H, m), 8.16 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 596 (M-1)

【0755】

化合物617 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物617を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.48 (2H, bs), 1.65–2.10 (14H, m), 2.74 (7H, m), 2.87 (2H, m), 2.94 (2H, m), 3.55 (2H, s), 7.10 (2H, dd, $J=8.6\text{Hz}$, $J=8.6\text{Hz}$), 7.46 (2H, m), 7.77 (2H, m), 7.92 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 8.18 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

【0756】

化合物618 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物618を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.48 (2H, bs), 1.70-2.08 (14H, m), 2.86 (11H, m), 3.55 (2H, s), 7.10 (1H, ddd, $J=8.3\text{Hz}$, $J=8.3\text{Hz}$, $J=2.4\text{Hz}$), 7.50 (5H, m), 7.91 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 8.20 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 600 ($M-1$)

【0757】

化合物619 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物619を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.47 (2H, bs), 1.86 (14H, m), 2.84 (11H, m), 3.53 (2H, s), 7.48 (3H, m), 7.91 (3H, m), 8.01 (1H, s), 8.31 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 684 ($M-1$)

【0758】

化合物620 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物620を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.47 (2H, bs), 1.85 (14H, m), 2.82 (11H, m), 3.53 (2H, bs), 3.

8.2 (3H, m), 6.90 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.69 (2H, d, $J=7.1$ Hz), 7.91 (2H, m), 8.15 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 612 (M-1)

【0759】

化合物 621 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 621 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.87 (4H, m), 2.29 (6H, s), 2.55 (10H, m), 2.72 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.16 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.43 (2H, m), 7.54 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.62 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 8.00 (1H, s), 8.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 572 (M-1)

【0760】

化合物 622 3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 622 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.85 (4H, m), 2.37 (3H, s), 2.54 (10H, m), 2.71 (2H, m), 2.85 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.20 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.43 (1H, dd, $J=7.8$ Hz, $J=7.8$ Hz), 7.54 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.66 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.92 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 8.00 (1H, s), 8.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 558 (M-1)

【0761】

化合物 623 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 623 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 1.87 (4H, m), 2.54 (10H, m), 2.73 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.11 (2H, dd, $J=8.7\text{ Hz}$, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.44 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.54 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.79 (2H, m), 7.92 (1H, m), 8.00 (1H, s), 8.12 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562 ($M-1$)

【0762】

化合物 624 N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 624 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 1.87 (4H, m), 2.54 (10H, m), 2.72 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.11 (1H, ddd, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.45 (5H, m), 7.92 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.00 (1H, s), 8.14 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562 ($M-1$)

【0763】

化合物 625 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-

1-イルメチル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 625 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.83 (4H, m), 2.53 (10H, m), 2.69 (2H, m), 2.82 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.44 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.54 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.92 (2H, m), 7.98 (1H, s), 8.01 (1H, s), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 646 ($M-1$)

【0764】

化合物 626 3-[4-(2-ヒドロキシーエチル) -ピペラジニン-1-イルメチル] -N-[3-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 626 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.85 (4H, m), 2.53 (10H, m), 2.70 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.59 (4H, m), 3.83 (3H, s), 6.90 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.42 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.53 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.72 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.99 (1H, s), 8.07 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574 ($M-1$)

【0765】

化合物 627 3-{[ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N-[3-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 627 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.14 (6H, m), 1.84 (4H, m), 2.25 (6H, m), 2.50 (2H, d, $J=5.6\text{ Hz}$)

), 2.62 (2H, m), 2.70 (2H, m), 2.83 (2H, m), 3.81-4.06 (4H, m), 7.08 (1H, m), 7.46 (3H, m), 7.60 (1H, s), 8.02 (2H, m), 8.20 (1H, bs).

質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

【0766】

化合物628 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物628を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.13 (6H, m), 1.87 (4H, m), 2.37 (3H, m), 2.50 (2H, d, $J=5.6\text{ Hz}$), 2.62 (2H, m), 2.71 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.93 (4H, m), 7.16 (2H, m), 7.44 (2H, m), 7.70 (2H, m), 8.00 (2H, m), 8.22 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

【0767】

化合物629 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物629を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.12 (6H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 1.88 (4H, m), 2.50 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.73 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.94 (4H, m), 7.06 (2H, dd, $J=8.6\text{ Hz}$, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.44 (2H, m), 7.85 (2H, m), 8.05 (2H, m), 8.25 (1H, d, $J=6.8\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

【0768】

化合物630 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物630を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.14 (6H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 1.84 (4H, m), 2.51 (2H, m), 2.66 (4H, m), 2.83 (2H, m), 3.95 (4H, m), 7.00 (1H, m), 7.23 (1H, m), 7.42 (3H, m), 7.72 (1H, m), 8.03 (1H, m), 8.18 (1H, s), 8.27 (1H, d, $J=10.3\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

【0769】

化合物631 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物631を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.12 (6H, m), 1.72 (4H, m), 2.52 (2H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.68 (6H, m), 3.97 (4H, m), 7.32 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.43 (2H, m), 7.87 (1H, m), 8.01 (2H, m), 8.30 (1H, s), 8.33 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 649 (M-1)

【0770】

化合物632 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシー-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

ミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 632 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 1.13 (6H, m), 1.86 (4H, m), 2.49 (2H, m), 2.62 (2H, m), 2.70 (2H, m), 2.81 (2H, m), 3.75-4.05 (7H, m), 6.82 (2H, m), 7.42 (2H, m), 7.74 (2H, m), 8.01 (1H, m), 8.06 (1H, s), 8.23 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

【0771】

化合物 633 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 633 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 1.64 (2H, m), 1.85 (6H, m), 2.25 (8H, m), 2.75 (6H, m), 3.63 (2H, s), 3.70 (1H, m), 7.15 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.43 (2H, m), 7.56 (1H, m), 7.61 (1H, s), 7.93 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.98 (1H, s), 8.06 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 543 (M-1)

【0772】

化合物 634 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 634 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 1.64 (2H, m), 1.86 (6H, m), 2.26 (2H, t, $J=9.5\text{ Hz}$), 2.37 (3H, s), 2.71 (2H, m), 2.81 (4H, m), 3.64 (2H, s), 3.72 (1H, m), 7.19 (2H, d, $J=7.9\text{ Hz}$), 7.43 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.57 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.66

(2 H, d, $J=7.9$ Hz), 7.94 (2 H, m), 8.09 (1 H, s)
質量分析 (ESI-MS) 529 (M-1)

【0773】

化合物635 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物635を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.64 (2 H, m), 1.90 (6 H, m), 2.23 (2 H, m), 2.80 (6 H, m), 3.62 (2 H, s), 3.73 (1 H, m), 7.11 (2 H, dd, $J=8.6$ Hz, $J=8.6$ Hz), 7.45 (1 H, m), 7.58 (1 H, m), 7.79 (2 H, dd, $J=8.6$ Hz, $J=8.6$ Hz), 7.94 (1 H, d, $J=7.8$ Hz), 7.99 (1 H, s), 8.12 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 (M-1)

【0774】

化合物636 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物636を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.69 (2 H, m), 1.90 (6 H, m), 2.42 (2 H, bs), 2.78 (6 H, m), 3.75 (3 H, m), 7.11 (1 H, m), 7.30-7.80 (5 H, m), 7.98 (2 H, m), 8.14 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 (M-1)

【0775】

化合物637 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 637 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.63 (2H, m), 1.85 (6H, m), 2.19 (2H, m), 2.74 (6H, m), 3.58 (2H, s), 3.71 (1H, m), 7.44 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.54 (2H, m), 7.94 (4H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 617 (M-1)

【0776】

化合物 638 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 638 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.62 (2H, m), 1.87 (6H, m), 2.19 (2H, m), 2.77 (6H, m), 3.59 (2H, s), 3.70 (1H, m), 3.83 (3H, s), 6.90 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.43 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.55 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.72 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.98 (1H, s), 8.06 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 545 (M-1)

【0777】

化合物 639 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 639 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.37 (2H, m), 1.49 (1H, m), 1.71 (2H, m), 1.86 (4H, m), 2.04 (2H, m), 2.29 (6H, s), 2.73 (2H, m), 2.86 (2H, m)

), 2.93 (2H, m), 3.49 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 3.62 (2H, s), 7.16 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.45 (2H, m), 7.58 (1H, m), 7.63 (1H, s), 7.94 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.99 (1H, s), 8.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 557 (M-1)

【0778】

化合物640 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物640を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.40 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.71 (2H, m), 1.89 (4H, m), 2.06 (2H, m), 2.38 (3H, m), 2.73 (2H, m), 2.86 (2H, m), 2.95 (2H, m), 3.49 (2H, d, $J=6.1$ Hz), 3.63 (2H, s), 7.21 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.45 (1H, dd, $J=7.7$ Hz, $J=14.9$ Hz), 7.59 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.68 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.97 (2H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 543 (M-1)

【0779】

化合物641 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物641を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.34 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.69 (2H, m), 1.84 (4H, m), 2.01 (2H, m), 2.71 (2H, m), 2.87 (4H, m), 3.49 (2H, d, $J=6.4$ Hz), 3.58 (2H, s), 7.10 (2H, dd, $J=8.5$ Hz), 7.43 (1H, m), 7.55 (1H, m), 7.78 (2H, m)

), 7.91 (1H, m), 7.98 (1H, bs), 8.13 (1H, s)
質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

【0780】

化合物642 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド
(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物642を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.35 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.70 (2H, m), 1.84 (4H, m), 2.01 (2H, m), 2.70 (2H, m), 2.83 (2H, m), 2.90 (2H, m), 3.49 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.58 (2H, s), 7.10 (1H, ddd, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=2.7\text{ Hz}$), 7.45 (5H, m), 7.90 (1H, d, $J=7.4\text{ Hz}$), 7.98 (1H, s), 8.14 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

【0781】

化合物643 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物643を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.39 (2H, m), 1.52 (1H, m), 1.72 (2H, m), 1.88 (4H, m), 2.05 (2H, m), 2.66-2.98 (6H, m), 3.50 (2H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.61 (2H, s), 7.46 (1H, m), 7.57 (1H, m), 7.86 (1H, m), 7.96 (3H, m), 8.04 (1H, s), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 631 (M-1)

【0782】

化合物 644 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド (実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 644 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.34 (2H, m), 1.49 (1H, m), 1.69 (2H, m), 1.84 (4H, m), 2.00 (2H, m), 2.69 (2H, m), 2.81 (2H, m), 2.88 (2H, m), 3.48 (2H, d, $J=6.4\text{ Hz}$), 3.57 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.90 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.43 (1H, m), 7.55 (1H, m), 7.70 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.91 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.97 (1H, m), 8.07 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

【0783】

化合物 645 N-{3-[N'-(3,4-ジメチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-4-メチル-チオフェン-2-イル}-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 645 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.87 (2H, m), 2.26 (9H, m), 2.56 (2H, m), 3.73 (2H, m), 3.82 (2H, s), 4.06 (2H, s), 6.46 (1H, s), 7.13 (1H, bs), 7.18 (1H, bs), 7.50 (1H, m), 7.57 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.93 (2H, m), 13.00 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

【0784】

化合物 646 3-[(3,4-ジメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5,6,7,8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4,5]チエノ[2,3-d]ピリミジン-4-オン

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 646 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.88 (4H, m), 2.31 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.80 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.33 (2H, s), 7.10–7.88 (7H, m), 8.03 (1H, s), 8.76 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 525 (M-1)

【0785】

化合物647 3-[(4-メチルーベンジリデン)ーアミノ]ー2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾールー3-イルスルファニルメチル)ーフェニル]ー5, 6, 7, 8-テトラヒドロー3H-ベンゾ[4, 5] チエノ[2, 3-d] ピリミジンー4-オン

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物647を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.88 (4H, m), 2.35 (3H, s), 2.80 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.34 (2H, s), 7.17 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.26 (1H, m), 7.37 (1H, m), 7.56 (2H, m), 7.76 (1H, s), 8.00 (2H, m), 8.81 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 511 (M-1)

【0786】

化合物648 3-[(4-フルオローベンジリデン)ーアミノ]ー2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾールー3-イルスルファニルメチル)ーフェニル]ー5, 6, 7, 8-テトラヒドロー3H-ベンゾ[4, 5] チエノ[2, 3-d] ピリミジンー4-オン

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物648を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 1.89 (4H, m), 2.81 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.36 (2H, s), 7.08 (2H, dd, $J=8.7\text{Hz}$), 7.31 (1H, m), 7.40 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.56 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.69 (2H, m), 7.76 (1H, m), 8.04 (1H, s), 8.92 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 515 (M-1)

【0787】

化合物 649 3-[(3-フルオロベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 649 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.89 (4H, m), 2.81 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.36 (2H, s), 7.15 (1H, m), 7.36 (5H, m), 7.55 (1H, m), 7.75 (1H, m), 8.03 (1H, s), 9.01 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 515 (M-1)

【0788】

化合物 650 3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 650 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.89 (4H, m), 2.68 (2H, m), 2.81 (2H, m), 4.37 (2H, s), 7.30-8.02 (7H, m), 8.06 (1H, m), 9.17 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 599 (M-1)

【0789】

化合物 651 3-[(4-メトキシーベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 651 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 1.88 (4H, m), 2.80 (2H, m), 3.05 (2H, m), 3.81 (3H, s), 4.33 (2

H, s), 6.87 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.28 (1H, m), 7.55 (1H, m), 7.61 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.76 (1H, m), 8.00 (1H, s), 8.73 (1H, s), 9.15 (1H, s)
質量分析 (ESI-MS) 527 (M-1)

【0790】

実施例 9

化合物 652 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル (化合物 A) (4.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン (2.8 ml)、3- (クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (3.0 ml) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステルを製造した (7.42 g, 収率 100%)。

【0791】

上記反応で得られた、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル (800 mg) を、無水塩化メチレン (5.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (580 μ l) N, N-ジエチルエチレンジアミン (化合物 B') (464 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、未精製の有用中間体である 2- {3- [(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンゾイルア

ミノ} -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを得た (902 mg、収率100%)。

【0792】

上記反応で得られた、2- {3- [(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンゾイルアミノ} -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを、エタノール (5.0 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (2 ml) を加え、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮し、ヒドラジン化合物3- [(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -N- (3-ヒドラジノカルボニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル) -ベンズアミドを製造した (464 mg、収率52%)。

【0793】

3- [(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -N- (3-ヒドラジノカルボニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル) -ベンズアミド (77 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて酢酸 (50.0 μ l)、3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (55.0 μ l) を添加し、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物652を製造した (58.4 mg、収率58%)。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 0.98 (6H, m), 1.85 (7H, m), 2.28 (6H, m), 2.45-2.90 (12H, m), 3.76 (2H, m), 7.14 (1H, m), 7.32-8.12 (7H, m)

質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

【0794】

化合物653 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベン

ズアミド

(実施例 9) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 653 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 0.98 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.38 (3H, s), 2.42-2.90 (12H, m), 3.75 (2H, m), 7.24 (2H, m), 7.40-8.15 (7H, m)

質量分析 (ESI-MS) 586 (M-1)

【0795】

化合物 654 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 9) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 654 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 0.93 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.48 (4H, m), 2.69 (6H, m), 2.80 (2H, m), 3.75 (2H, m), 7.06 (2H, m), 7.40-7.95 (6H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 590 (M-1)

【0796】

化合物 655 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 9) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 655 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) : δ 0.94 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.62 (12H, m), 3.76 (2H, m), 7.08 (1H, m), 7.29-8.20 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 590 (M-1)

【0797】

化合物 656 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル } -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 9) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 656 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 0.93 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.62 (12H, m), 3.77 (2H, m), 7.40-8.30 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 674 (M-1)

【0798】

化合物 657 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル } -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 9) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 657 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 0.98 (6H, m), 1.87 (7H, m), 2.63 (12H, m), 3.77 (2H, m), 3.84 (3H, s), 6.89 (2H, m), 7.40-8.10 (7H, m)

質量分析 (ESI-MS) 602 (M-1)

【0799】

化合物 658 N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 658 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.80 (2H, m), 2.30 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.53 (2H, t, $J=7.4\text{ Hz}$), 3.62 (2H, m), 3.85 (2H, s), 7.00 (1H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 7.18 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.52 (3H, m), 7.64 (2H, m), 7.90 (1H, s), 7.97 (1H, s), 8.

28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

【0800】

化合物 659 3- (3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル) -N- [3- (4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 659 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.79 (2H, m), 2.35 (3H, s), 2.53 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.62 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 3.82 (2H, s), 6.97 (1H, d, $J=5.8\text{ Hz}$), 7.21 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.49 (2H, m), 7.60 (1H, d, $J=7.80$), 7.69 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.87 (1H, m), 7.94 (1H, s), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 466 (M-1)

【0801】

化合物 660 N- [3- (4-フルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 660 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.80 (2H, m), 2.53 (2H, t, $J=7.4\text{ Hz}$), 3.62 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 3.82 (2H, s), 6.96 (1H, d, $J=5.9\text{ Hz}$), 7.14 (2H, dd, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.48 (2H, m), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.85 (3H, m), 7.93 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 470 (M-1)

【0802】

化合物 661 N- [3- (3-フルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシープロピルスルファニル

メチル) -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物661を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.80 (2H, m), 2.54 (2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 3.62 (2H, t, $J=9.4\text{Hz}$), 3.86 (2H, s), 7.03 (1H, d, $J=5.8\text{Hz}$), 7.17 (1H, m), 7.42-7.80 (6H, m), 7.87 (1H, m), 7.98 (1H, bs), 8.35 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 470 (M-1)

【0803】

化合物662 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物662を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.80 (1H, m), 2.54 (2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 3.62 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 3.86 (2H, s), 7.03 (1H, d, $J=5.8\text{Hz}$), 7.53 (2H, m), 7.66 (2H, m), 7.90 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.98 (1H, bs), 8.04 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.33 (1H, s), 8.38 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 554 (M-1)

【0804】

化合物663 3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-N-[3-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物663を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 1.80 (2H, m), 2.54 (2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 3.62 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 3.85 (6H, m), 6.99 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.02 (1H, s, $J=5.9\text{Hz}$), 7.53 (2H, m), 7.65 (1H, d, $J=7$

. 8 Hz), 7.79 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.90 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 8.30 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 482 (M-1)

【0805】

化合物 664 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 664 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.22 (9H, m), 2.62 (8H, m), 3.59 (2H, s), 6.77 (1H, d, $J=5.4$ Hz), 7.09 (1H, m), 7.44 (5H, m), 7.94 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

【0806】

化合物 665 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 665 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 1.03 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.21 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.59 (8H, m), 3.58 (2H, s), 6.80 (1H, d, $J=4.6$ Hz), 7.16 (2H, m), 7.42 (2H, m), 7.58 (3H, m), 7.93 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.98 (1H, s), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

【0807】

化合物 666 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 666 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.21 (3H, s), 2.62 (8H, m), 3.58 (2H, s), 6.78 (1H, d, $J=4.6\text{Hz}$), 7.02 (2H, m), 7.42 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.67 (2H, m), 7.91 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.96 (1H, s), 8.36 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 508 ($M-1$)

【0808】

化合物667 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物667を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.04 (6H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.20 (3H, s), 2.60 (8H, m), 3.57 (2H, s), 6.76 (1H, bs), 7.02 (1H, m), 7.41 (6H, m), 7.91 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.97 (1H, s), 8.38 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 508 ($M-1$)

【0809】

化合物668 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物668を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 1.02 (6H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.20 (3H, s), 2.58 (8H, m), 3.56 (2H, s), 6.74 (1H, bs), 7.41 (2H, m), 7.54 (2H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J=8.3\text{Hz}$, $J=1.4\text{Hz}$), 7.88 (2H, m), 7.96 (1H, s), 8.45 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 592 ($M-1$)

【0810】

化合物 669 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル } -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 669 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.01 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 2.19 (3H, s), 2.56 (8H, m), 3.56 (2H, s), 3.75 (3H, s), 6.75 (1H, m), 6.81 (2H, m), 7.42 (2H, m), 7.87 (3H, m), 7.90 (1H, d, $J=7.8$ 4), 7.97 (1H, s), 8.32 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520 ($M-1$)

【0811】

化合物 670 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル } -N- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 670 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.11 (6H, m), 2.30 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.52 (4H, m), 3.83 (4H, m), 7.01 (1H, d, $J=5.8$ Hz), 7.19 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.53 (3H, m), 7.67 (2H, m), 7.93 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 8.06 (1H, m), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 521 ($M-1$)

【0812】

化合物 671 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル } -N- [3- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 671 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.11 (6H, d, $J=6.1$ Hz), 2.39 (3H, s), 2.52 (4H, m), 3.82 (4H, m)

), 7.01 (1H, m), 7.26 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.53 (2H, m), 7.68 (1H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.74 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.92 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.06 (1H, m), 8.33 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

【0813】

化合物672 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物672を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.10 (6H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 2.51 (4H, m), 3.86 (4H, m), 7.02 (1H, d, $J=5.9\text{ Hz}$), 7.18 (2H, dd, $J=8.4\text{ Hz}$, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.53 (2H, m), 7.68 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.91 (3H, m), 8.06 (1H, m), 8.35 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 511 (M-1)

【0814】

化合物673 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物673を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 1.11 (6H, m), 2.52 (4H, m), 3.87 (4H, m), 7.03 (1H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 7.15 (1H, m), 7.40-7.75 (6H, m), 7.90 (1H, m), 8.07 (1H, m), 8.36 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 511 (M-1)

【0815】

化合物674 3- [(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン)-アミノ]-2- (3- { [(2-ジエチルアミノエチル)-メチルアミノ]

] -メチル} -フェニル) - 5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ [4, 5] チエノ [2, 3-d] ピリミジン-4-オン

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 674 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 0.99 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 1.90 (4H, m), 2.12 (3H, s), 2.50 (8H, m), 2.82 (2H, m), 3.05 (2H, m), 3.52 (2H, s), 7.38 (2H, m), 7.54 (2H, m), 7.62 (1H, bs), 7.78 (1H, m), 7.98 (1H, m), 9.18 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 630 ($M+1$)

【0816】

化合物 675 2- (3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -フェニル) - 3- [(4-メトキシ-ベンジリデン) -アミノ] - 5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ [4, 5] チエノ [2, 3-d] ピリミジン-4-オン

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 675 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 1.00 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 1.89 (4H, m), 2.11 (3H, s), 2.52 (8H, m), 2.81 (2H, m), 3.06 (2H, m), 3.50 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.89 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.35 (2H, m), 7.58 (1H, m), 7.66 (3H, m), 8.77 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 558 ($M+1$)

【0817】

化合物 676 N- [4-プロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3- (2-ヒドロキシ-エタンスルフォニルメチル) -ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 676 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.58 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.34 (1H, s), 8.07 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 8.00 (2H, s), 7.23-7.78 (3H, m), 7.57-7.63 (

2 H, m), 7. 27 (2 H, d, $J=2.0$ Hz), 4. 39 (1 H, d, $J=13.2$ Hz), 4. 20 (1 H, d, $J=13.2$ Hz), 3. 96-4. 05 (2 H, m), 3. 00-3. 15 (1 H, m), 2. 80-2. 95 (1 H, m), 2. 39 (3 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 556, 558 (M-1)

【0818】

化合物677 N-[4-ブromo-2-(4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシエタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例6に記載の方法に従って、表題の化合物677を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8. 61 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8. 34 (1 H, s), 8. 06-8. 13 (2 H, m), 8. 04 (1 H, d, $J=8.3$ Hz), 7. 72-7. 79 (4 H, m), 7. 60 (1 H, dd, $J=7.8$ Hz, $J=7.8$ Hz), 7. 28 (2 H, d, $J=8.1$ Hz), 4. 83 (2 H, s), 4. 05 (2 H, t, $J=5.6$ Hz), 3. 20 (2 H, t, $J=5.6$ Hz), 2. 39 (3 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 542, 543 (M-1)

【0819】

化合物678 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシエタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例6に記載の方法に従って、表題の化合物678を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8. 55 (1 H, d, $J=9.0$ Hz), 8. 40 (1 H, s), 8. 32 (1 H, s), 8. 07 (1 H, d, $J=2.0$ Hz), 8. 05 (1 H, s, $J=8.5$ Hz), 7. 96-8. 05 (2 H, m), 7. 77 (1 H, dd, $J=2.0$ Hz, $J=8.8$ Hz), 7. 69 (1 H, d, $J=8.3$ Hz), 7. 56-7. 66 (2 H, m), 4. 39 (1 H, d, $J=12.9$ Hz), 4. 20 (1 H, d, $J=13.2$ Hz), 3. 96-4. 03 (2 H, m), 3. 03-3. 13 (1 H, m),

2. 87 (1H, dt, $J=4.2\text{ Hz}$, $J=13.4\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 664, 646 (M-1)

【0820】

化合物 679 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 679 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): 8.70-8.80 (1H, m), 8.20-8.27 (1H, m), 8.05-8.15 (2H, m), 7.97 (2H, s), 7.60-7.70 (3H, m), 7.49-7.60 (2H, m), 4.52 (2H, m), 4.22-4.26 (2H, m), 3.10-3.15 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 628, 630 (M-1)

【0821】

化合物 680 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 680 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 7.93-7.97 (2H, m), 7.85-7.90 (1H, m), 7.69 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 7.63 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.58 (2H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.40-7.48 (2H, m), 7.18 (2H, m), 6.29-6.33 (1H, m), 6.21 (1H, d, $J=3.2\text{ Hz}$), 3.81 (2H, s), 3.64 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520, 522 (M-1)

【0822】

化合物 681 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -3- (フラン-2-イルメチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 681 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.64 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 7.85-7.96 (5H, m), 7.62 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.57 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, $J=7.7\text{ Hz}$), 7.40-7.42 (1H, m), 7.18 (2H, dd, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.31 (1H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, $J=3.2\text{ Hz}$), 6.21 (1H, d, $J=3.2\text{ Hz}$), 3.81 (2H, s), 3.64 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520, 522 ($M-1$)

【0823】

化合物 682 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 682 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 7.91-7.96 (2H, m), 7.85-7.90 (1H, m), 7.73 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.62 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.58 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.40-7.42 (1H, m), 7.26 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 6.29-6.33 (1H, m), 6.20-6.23 (1H, m), 3.82 (2H, s), 3.64 (2H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 516, 518 ($M-1$)

【0824】

化合物 683 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3-(フラン-2-イルメチルスルファニ

ルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 683 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.66 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.30 (1H, s), 7.86-7.98 (3H, m), 7.48-7.78 (5H, m), 7.41 (1H, s), 7.15-7.27 (1H, m), 6.29-6.35 (1H, m), 6.20-6.25 (1H, m), 3.82 (2H, s), 3.64 (2H, s), 2.31 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 530, 532 ($M-1$)

【0825】

化合物 684 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3,4-ジメチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-{ [3-[(3-{ [4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3,4-ジメチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) プロピル] (メチル) アミノ) メチル) ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 684 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 11.57 (2H, s), 10.57 (2H, s), 8.67 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 8.44 (2H, s), 7.80 (2H, s), 7.71-7.73 (2H, m), 7.64 (2H, s), 7.56 (2H, s), 7.38 (4H, dd, $J=7.8$ Hz, $J=7.8$ Hz), 7.20-7.35 (4H, m), 7.10 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 3.53 (4H, s), 2.46 (4H, s), 2.23 (6H, s), 2.18 (6H, s), 2.14 (6H, s), 1.80 (2H, s), 1.61 (4H, s)

質量分析 (ESI-MS) 935 ($M-1$)

【0826】

化合物 685 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-{ [3-[(3-{ [4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) プロピル] (メチル) アミノ) メチル) ベンズアミド

ル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル}
(メチル) アミノ) プロピル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 685 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : 8.59 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 8.40 (2H, s), 7.88-7.90 (4H, m), 7.85 (2H, s), 7.79 (2H, d, $J=7.1$ Hz), 7.63 (2H, d, $J=10.5$ Hz), 7.52-7.58 (4H, m), 7.35-7.45 (6H, m), 7.12-7.20 (2H, m), 3.62 (4H, s), 2.53 (4H, m), 2.23 (6H, s), 1.78-1.85 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 915 ($M-1$)

【0827】

化合物 686 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 686 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.64 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.30 (1H, s), 8.01 (2H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.52-7.68 (5H, m), 7.20 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 6.50 (1H, d, $J=3.2$ Hz), 6.42-6.45 (1H, m), 4.25-4.37 (2H, m), 4.11 (1H, d, $J=4.7$ Hz), 4.08 (1H, d, $J=4.7$ Hz), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562, 564 ($M-1$)

【0828】

化合物 687 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 687 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 6.37 (1H, s), 8.7

2 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 8.00–8.22 (3H, m), 7.40–7.80 (7H, m), 6.54 (1H, d, $J=3.4$ Hz), 6.40–6.45 (1H, m), 4.29 (2H, s), 4.20 (2H, s), 2.29 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 546, 548 ($M-1$)

【0829】

化合物688 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例6に記載の方法に従って、表題の化合物688を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.60 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.89–8.07 (4H, m), 7.55–7.73 (5H, m), 6.49 (1H, m), 6.41–6.46 (1H, m), 4.31 (2H, dd, $J=13.4$ Hz, $J=15.8$ Hz), 4.09 (2H, dd, $J=10.0$ Hz, $J=14.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 636, 638 ($M-1$)

【0830】

化合物689 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例6に記載の方法に従って、表題の化合物689を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.60 (1H, d, $J=9.3$ Hz), 8.39 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.98–8.09 (3H, m), 7.94 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 7.69 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.56–7.67 (3H, m), 6.55 (1H, d, $J=3.2$ Hz), 6.40–6.47 (1H, m), 4.54 (2H, s), 4.51 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 620 ($M-1$)

【0831】

化合物 690 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル) フェニル)-3-{ [{6-[(3-{ [4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 690 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 1125, 1127 (M-1)

【0832】

化合物 691 2-{3-[4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニルカルバモイル]-ベンジルスルファニル}-エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 691 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.53 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.34 (1H, s), 7.40-8.00 (10, m), 4.84 (2H, s), 2.90-3.10 (2H, m), 2.70-2.86 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 548 (M-1)

【0833】

化合物 692 2-{3-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニルカルバモイル]-ベンジルスルファニル}-エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 692 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.56 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 7.20-8.35 (11H, m), 3.84-3.90 (2H, m), 2.92-3.04 (2H, m), 2.70-2.88 (2H, m), 2.30-2.40 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

【0834】

化合物 693 2- {3- [4-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 693 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.55 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.32 (1H, s), 7.10-8.00 (10H, m), 3.88 (2H, s), 2.90-3.10 (2H, m), 2.68-2.86 (2H, m), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 544 ($M-1$)

【0835】

化合物 694 2- {3- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 694 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.56 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.29 (1H, s), 7.46-8.00 (8H, m), 7.18-7.25 (1H, m), 3.87 (2H, s), 2.94-3.10 (2H, m), 2.75-2.86 (2H, m), 2.25-2.35 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 582 ($M+23$)

【0836】

化合物 695 6-ブromo-3- [(4-フルオロ-ベンジリデン) -アミノ] -2- [3- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -フェニル] -3H-キナゾリン-4-オン

実施例 10 に記載の方法に従って、表題の化合物 695 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.98-9.00 (1H, m), 8.46 (1H, s), 7.85 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, $J=8.5$ Hz), 7.65-7.72 (3H, m), 7.58 (1H, dd, $J=1.7$ Hz, $J=7.3$ Hz), 7.35-7.43 (2H, m), 7.07-7.

1.3 (3H, m), 3.73 (2H, s), 3.56-3.64 (2H, m),
2.52-2.58 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 534, 536, 537 (M+23)

【0837】

化合物696 6-ブromo-2-[3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-フェニル]-3-[(4-メチル-ベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例10に記載の方法に従って、表題の化合物696を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.85 (1H, s), 8.41 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.91 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.79 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.59-7.64 (2H, m), 7.52-7.56 (3H, m), 7.28-7.36 (2H, m), 7.14-7.20 (1H, m), 3.67 (2H, s), 3.49 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.46 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.36 (1H, s), 2.33 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 530, 532, 533 (M+23)

【0838】

化合物697 6-ブromo-3-[(3,4-ジメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例10に記載の方法に従って、表題の化合物697を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.78 (1H, s), 8.41 (2H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.79 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.64 (1H, s), 7.60 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.53-7.57 (1H, m), 7.42 (1H, s), 7.28-7.38 (3H, m), 7.11 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 3.67 (2H, s), 3.49 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.46 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.24 (3H, s), 2.22-2.27 (1H, m), 2.20 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 546, 547 (M+23)

【0839】

化合物698 6-プロモ-3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例10に記載の方法に従って、表題の化合物698を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 9.27 (1H, s), 8.46 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.94 (1H, s), 7.86 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.75 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.65-7.68 (2H, m), 7.54 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.32-7.45 (2H, m), 3.75 (2H, s), 3.61 (2H, dt, $J=5.9\text{ Hz}$, $J=5.9\text{ Hz}$), 2.57 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.03 (1H, t, $J=6.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 620 (M+23)

【0840】

化合物699 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物699を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.65 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.34 (1H, s), 7.91-7.96 (2H, m), 7.85-7.90 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.61 (2H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.57 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.49 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.41 (1H, dd, $J=0.8\text{ Hz}$, $J=2.0\text{ Hz}$), 7.24-7.34 (2H, m), 6.30 (1H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, $J=3.2\text{ Hz}$), 6.21 (1H, d, $J=3.2\text{ Hz}$), 3.81 (2H, s), 3.63 (2H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 516, 518 (M-1)

【0841】

化合物700 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物700を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.62 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.39 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.04 (1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 7.92-7.96 (2H, m), 7.87 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.69 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.64 (1H, dd, $J=2.4\text{Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 7.57 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, $J=7.7\text{Hz}$), 7.40 (1H, dd, $J=0.8\text{Hz}$, $J=2.0\text{Hz}$), 6.28-6.33 (1H, m), 6.21 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 3.81 (2H, s), 3.64 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 604, 606 ($M-1$)

【0842】

化合物701 N1-[4-クロロ-2-(2-[(E)-1-(4-フルオロフェニル)メチリデン]ヒドラジノ)カルボニル]フェニル]-3-{[3-[(3-{[4-クロロ-2-(2-[(E)-1-(4-フルオロフェニル)メチリデン]ヒドラジノ)カルボニル]アニリノ)カルボニル]ベンジル](メチル)アミノ)プロピル)(メチル)アミノ]メチル}ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物701を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.59 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.41 (2H, s), 7.82-7.90 (8H, m), 7.79 (2H, d, $J=7.1\text{Hz}$), 7.53 (2H, dd, $J=2.4\text{Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 7.35-7.45 (4H, m), 7.14 (4H, dd, $J=8.8\text{Hz}$, $J=8.8\text{Hz}$), 3.59 (4H, s), 2.49 (4H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2.20 (6H, s), 1.75-1.85 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 915, 917 ($M-1$)

【0843】

化合物 702 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(4-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-[{3-[(3-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(4-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) プロピル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 702 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.66 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 8.46 (2H, s), 7.72-7.82 (4H, m), 7.58-7.68 (6H, m), 7.25-7.40 (4H, m), 7.12-7.16 (6H, m), 3.53 (4H, bs), 2.46 (4H, bs), 2.15 (6H, bs), 1.81 (2H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 907, 909 (M-1)

【0844】

実施例 10

化合物 703 2-(3-{6-クロロ-3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン) -アミノ]-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-2-イル}-ベンジルスルファニル)-エタンスルフォニック アシッド

メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート (化合物 A) (4.0 g) を、無水塩化メチレン (80.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.8 ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (5.0 g) をそれぞれ加え、同温度にて 2 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-クロロ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (3.32 g, 収率 100%) を得た。

続いて、メチル 5-クロロ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (1.8 g) を、無水塩化メチレンに溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1.5 ml)、2-メルカプトエタンスルフォニックアシッドナト

リウムソルト (化合物 B') (1.3 g) を加え、40℃にて4日間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、有用中間体である 5-クロロ-2-[3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.08 g、収率 46.1%) を得た。

上記反応で得られた、5-クロロ-2-[3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.08 g) を、エタノール (11.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (1.0 ml) を加え、加熱還流下で3日間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷した後、反応液をそのまま濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、キナゾロン化合物である 2-[3-(3-アミノ-6-クロロ-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-2-イル)-ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (542 mg、収率 52.1%) を得た。

2-[3-(3-アミノ-6-クロロ-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-2-イル)-ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて、4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (化合物 C) (50.0 μ l) を添加し、加熱還流下にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物 703 (32.0 mg、収率 44.0%) を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 9.16 (1H, s), 8.15-8.25 (1H, m), 7.38-7.90 (9H, m), 3.84 (2H, s), 2.97-3.05 (2H, m), 2.80-2.87 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 614, 616 (M-1)

【0845】

化合物704 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-[{6-[(3-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物704を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.60 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 8.35 (2H, s), 7.88-7.95 (4H, m), 7.30-7.80 (14H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 3.69 (4H, s), 2.47 (4H, t, $J=7.3$ Hz), 2.27 (6H, s), 1.50-1.60 (4H, m), 1.25-1.37 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 957 (M-1)

【0846】

化合物705 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-[{6-[(3-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(3-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物705を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.61 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 8.35 (2H, s), 7.85-7.93 (4H, s), 7.63 (2H, s), 7.45-7.57 (10H, m), 7.14-7.30 (4H, m), 3.58 (4H, s), 2.35-2.45 (4H, m), 2.34 (6H, s), 2.18 (6H, s), 1.53 (4H, bs), 1.32 (4H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 949 (M-1)

【0847】

化合物 706 N1-[4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(4-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3- { [{6-[(3- { [4-クロロ-2-({2-[(E)-1-(4-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ} ヘキシル) (メチル) アミノ} メチル] ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 706 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.60 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 8.34 (2H, s), 7.83-7.98 (8H, m), 7.66 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.48-7.60 (4H, m), 7.21 (6H, d, $J=7.8$ Hz), 3.78 (4H, s), 2.55-2.60 (4H, m), 2.30-2.35 (12H, m), 1.59 (4H, bs), 1.35 (4H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 949 (M-1)

【0848】

化合物 707 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 707 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 609, 611, 612 (M-1)

【0849】

化合物 708 2- {3-[4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 708 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.54 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.34 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.35-7.92 (7H, m), 7.14-7.22 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.95-3.06 (2H, m), 2.70-2.86 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 548 (M-1)

【0850】

実施例 11

化合物 709 2-〔3-〔4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニルカルバモイル〕-ベンジルスルファニル〕-エタンスルフォニック アシッド

メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート (化合物 A) (4.0 g) を、無水塩化メチレン (80.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.8 ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (5.0 g) をそれぞれ加え、同温度にて 2 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-クロロ-2-〔3-(クロロメチル) ベンゾイル〕アミノベンゾエート (3.32 g, 収率 100%) を得た。

続いて、メチル 5-クロロ-2-〔3-(クロロメチル) ベンゾイル〕アミノベンゾエート (1.8 g) を、無水塩化メチレンに溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1.5 ml)、2-メルカプトエタンスルフォニックアシッドナトリウムソルト (化合物 B') (1.3 g) を加え、40℃にて 4 日間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、有用中間体である 5-クロロ-2-〔3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ〕-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.08 g, 収率 46.1%) を得た。

上記反応で得られた、5-クロロ-2-〔3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ〕-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.27 g) を、エタノール (15.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (2.0 ml) を加え、40℃にて 12 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷した後、反応液をそのまま濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヒドラジン化合物である 2-〔3-

(4-クロロ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニルカルバモイル)-ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (820 mg、収率67.2%)を得た。

2-[3-(4-クロロ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニルカルバモイル)-ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (50.0 mg)を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて、4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (化合物C) (50.0 μ l) を添加し、加熱還流下にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物709 (47.2 mg、収率56.0%)を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.52 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.38-8.40 (10H, m), 3.89 (2H, s), 2.94-3.06 (2H, m), 2.70-2.88 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 632 (M-1)

【0851】

化合物710 3-[[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル]-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物710を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.18 (1H, bs), 7.88-8.03 (3H, m), 7.64-7.70 (2H, m), 7.59 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.46-7.55 (1H, m), 7.25 (2H, bs), 3.64 (2H, s), 2.72 (2H, bs), 2.53-2.65 (6H, m), 2.37 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.04 (6H, t, $J=7.3$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 520 (M+1)

【0852】

化合物 711 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -
メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニ
ル) -4-メチルーチオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 711 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 7.88-8.18 (3H, m), 7.37-7.64 (5H, m), 7.19 (1H, s), 3.63 (2H, s), 2.67-2.75 (2H, m), 2.53-2.65 (6H, m), 2.20-2.35 (12H, m), 0.98-1.10 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 532 (M-1), 534 (M+1)

【0853】

化合物 712 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -
メチル} -N- [2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)
-4-メチルーチオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 712 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 7.90-8.03 (3H, m), 7.72 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.59 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.38-7.56 (2H, m), 6.97 (2H, bs), 3.84 (2H, s), 3.64 (2H, s), 2.67-2.75 (2H, m), 2.53-2.65 (6H, m), 2.27 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.00-1.10 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1), 536 (M+1)

【0854】

化合物 713 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ
ジノカルボニル) -フェニル] -4- [(2-モルホリン-4-イル-エチルア
ミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 713 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.43 (2H, bs), 7.99 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.68 (1H, s), 7.36-7.6

0 (6H, m), 7.13 (1H, ddd, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=2.0\text{ Hz}$), 3.89 (2H, s), 3.68-3.73 (4H, m), 2.72 (2H, t, $J=5.9\text{ Hz}$), 2.53 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.43 (4H, t, $J=4.4\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

【0855】

化合物 714 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 714 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.51 (1H, s), 8.31 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.65 (1H, s), 7.58 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.47 (3H, d, $J=7.7\text{ Hz}$), 3.89 (2H, s), 3.71 (4H, t, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.71 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.53 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.43 (4H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 664, 666 (M-1)

【0856】

化合物 715 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 715 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.43 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.38 (1H, s), 7.98 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.68-7.77 (3H, m), 7.48 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.41 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 6.90 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.86 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.68-3.72 (4H, m), 2.69 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.51 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.38-2.45 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

【0857】

化合物716 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物716を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.40-8.46 (2H, m), 7.98 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.71 (1H, s), 7.49 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.42 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.35 (1H, s), 7.30 (2H, d, $J=5.6\text{ Hz}$), 3.86 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.70 (4H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 2.69 (2H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 2.51 (2H, t, $J=5.8\text{ Hz}$), 2.40-2.47 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 596 (M+1)

【0858】

化合物717 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(4-フルオロフェニル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物717を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): δ 8.57 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.28 (1H, s), 8.00 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.55-7.73 (3H, m), 7.48 (3H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.18 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 6.93-6.98 (2H, m), 6.85-6.90 (2H, m), 3.63 (2H, s), 3.13 (4H, t, $J=4.6\text{ Hz}$), 2.62 (4H, bs), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 642 (M-1)

【0859】

化合物718 4-{[ビス-(2-ヒドロキープロピル)-アミノ]-メチ

ル} -N- [4-ブromo-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 718 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.53 (1H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8.35 (1H, s), 8.02 (2H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.70 (2H, s), 7.53-7.60 (2H, m), 7.45 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.32 (1H, dd, $J=7.4\text{ Hz}$, $J=7.4\text{ Hz}$), 3.60-3.99 (4H, m), 2.42-2.66 (4H, m), 2.39 (3H, s), 1.12 (6H, d, $J=6.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 581 ($M+1$)

【0860】

化合物 719 4- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブromo-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 719 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.53 (1H, bs), 8.37 (1H, bs), 8.00 (2H, bs), 7.81 (2H, bs), 7.70 (1H, bs), 7.40-7.60 (3H, m), 7.05-7.15 (2H, m), 3.83-3.98 (2H, m), 3.65-3.78 (2H, m), 2.45-2.60 (4H, m), 1.20-1.30 (3H, m), 1.06-1.16 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 587 ($M+1$)

【0861】

化合物 720 4- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 720 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.45-8.54 (1H, m), 8.39 (1H, s), 8.00 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.36

—7.74 (7H, m), 7.10—7.20 (1H, m), 3.80—4.02 (4H, m), 2.47—2.60 (4H, m), 1.12 (6H, d, $J=6.4\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 585 ($M+1$)

【0862】

化合物 721 4- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 721 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.46 (2H, bs), 7.95—8.08 (3H, m), 7.45—7.75 (4H, m), 7.13—7.20 (2H, m), 3.60—4.03 (4H, m), 2.47—2.68 (4H, m), 1.12 (6H, d, $J=6.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 667, 669 ($M-1$)

【0863】

化合物 722 4- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-ブロモ-2-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 722 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.37—8.47 (2H, m), 7.98 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.70—7.74 (3H, m), 7.38—7.53 (3H, m), 6.90 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.77—3.95 (4H, m), 3.81 (3H, s), 2.42—2.64 (4H, m), 1.08—1.14 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 597 ($M+1$)

【0864】

化合物 723 4- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-ブロモ-2-(3-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 723 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : δ 8.57 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8.34 (1H, s), 8.00 (2H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.72 (1H, s), 7.55–7.62 (1H, m), 7.46 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.30–7.40 (3H, m), 6.95–7.02 (1H, m), 3.80–4.00 (4H, m), 3.86 (3H, s), 2.40–2.65 (4H, m), 1.09–1.15 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 597 (M-1)

【0865】

化合物 724 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 724 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.56–8.66 (1H, m), 7.96 (2H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.65–7.78 (3H, m), 7.46–7.56 (3H, m), 7.13–7.22 (3H, m), 6.72–6.78 (2H, m), 4.80–4.90 (1H, m), 3.75–3.90 (2H, m), 2.73–2.82 (1H, m), 2.58–2.66 (1H, m), 2.40–2.45 (3H, m), 2.28–2.32 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 629 (M-1)

【0866】

化合物 725 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 725 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 8.61 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.36 (1H, s), 8.07 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.92 (2H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 7.56 (1H, dd, $J=2.2\text{ Hz}$)

, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.70 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.42-7.49 (3H, m), 7.10-7.24 (3H, m), 6.75 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 4.70-4.75 (1H, m), 3.68 (2H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2.67 (1H, dd, $J=12.7\text{ Hz}$, $J=8.5\text{ Hz}$), 2.50 (1H, dd, $J=4.9\text{ Hz}$, $J=12.7\text{ Hz}$), 2.33 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 619 (M-1)

【0867】

化合物 726 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシー-2-(4-ヒドロキシー-フェニル)-エチル]-メチル-アミノ} -メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 726 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.61 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.40 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.04-8.10 (2H, m), 7.90-7.95 (2H, m), 7.77 (1H, dd, $J=9.0\text{ Hz}$, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.69 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.13 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 6.75 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 4.70-4.80 (1H, m), 3.70 (2H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2.68 (1H, dd, $J=8.3\text{ Hz}$, $J=12.8\text{ Hz}$), 2.52 (1H, dd, $J=4.6\text{ Hz}$, $J=12.7\text{ Hz}$), 2.36 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 701, 703 (M-1)

【0868】

化合物 727 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシー-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシー-2-(4-ヒドロキシー-フェニル)-エチル]-メチル-アミノ} -メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 727 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.63 (1H, d, $J=9.$

0 Hz), 8.34 (1H, s), 8.07 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.94 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.75 (1H, dd, $J=8.8$ Hz, $J=2.2$ Hz), 7.61 (1H, bs), 7.44 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.26-7.36 (2H, m), 7.13 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 6.97-7.03 (1H, m), 6.76 (2H, d, $J=8.6$ Hz), 4.72-4.82 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.76 (2H, d, $J=5.8$ Hz), 2.72 (1H, dd, $J=8.6$ Hz, $J=13.0$ Hz), 2.41 (3H, s), 2.57 (1H, dd, $J=4.9$ Hz, $J=13.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 629 (M-1)

【0869】

化合物728 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物728を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.49 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.41 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.73 (1H, s), 7.68 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.51 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.41 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.19-7.23 (3H, m), 3.47-3.75 (10H, m), 3.16 (2H, s), 2.40-2.56 (8H, m), 2.36 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 659 (M-1)

【0870】

化合物729 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物729を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz): δ 8.48 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.42 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7

. 66-7. 75 (2H, m), 7. 49-7. 56 (2H, m), 7. 41 (2H, d, J=7. 8 Hz), 7. 20-7. 32 (2H, m), 3. 48-3. 76 (10H, m), 3. 16 (2H, s), 2. 40-2. 56 (8, m), 2. 38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 661 (M-1)

【0871】

化合物730 N-[4-プロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物730を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8. 48 (1H, d, J=9. 0 Hz), 8. 43 (1H, s), 7. 97 (2H, d, J=7. 8 Hz), 7. 76-7. 87 (2H, m), 7. 68-7. 73 (1H, m), 7. 49-7. 57 (1H, m), 7. 42 (2H, d, J=7. 8 Hz), 7. 11 (2H, dd, J=8. 5 Hz, J=8. 5 Hz), 3. 49-3. 76 (10H, m), 3. 16 (2H, s), 2. 40-2. 65 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 665 (M-1)

【0872】

化合物731 N-[4-プロモ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物731を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8. 42-8. 52 (2H, m), 7. 96 (2H, d, J=7. 8 Hz), 7. 73 (1H, s), 7. 46-7. 60 (3H, m), 7. 33-7. 44 (3H, m), 7. 11 (1H, ddd, J=2. 4 Hz, J=8. 3 Hz, J=8. 3 Hz), 3. 48-3. 76 (10H, m), 3. 15 (2H, s), 2. 40-2. 60 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 665 (M-1)

【0873】

化合物732 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物732を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.50 (2H, s, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.45 (1H, s), 7.95 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.78 (1H, s), 7.51 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.25-7.43 (3H, m), 6.90-7.00 (2H, m), 3.83 (3H, s), 3.48-3.75 (10H, m), 3.16 (2H, s), 2.40-2.60 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 675, 677 ($M-1$)

【0874】

化合物733 4-{|ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ}-メチル|-N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物733を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz): δ 8.36-8.46 (2H, m), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.66 (2H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 7.45-7.51 (4H, m), 7.17 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 3.79 (2H, s), 3.52 (4H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.46 (4H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 2.76 (4H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.19 (6H, t, $J=7.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 622, 624 ($M-1$)

【0875】

化合物734 4-{|ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ}-メチル|-N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物734を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 8.45 (1H, s), 8.36 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.98 (2H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.65-7.71 (3H, m), 7.45-7.48 (3H, m), 7.20 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 3.79 (2H, s), 3.53 (4H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 3.46 (4H, q, $J=7.9\text{Hz}$), 2.76 (4H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 2.35 (3H, s), 1.19 (6H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 607, 609 ($M-1$)

【0876】

化合物 735 4- { [ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブロモ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 735 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.47 (1H, s), 8.34 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.68 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.54 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.42-7.50 (3H, m), 7.20-7.34 (2H, m), 3.78 (2H, s), 3.52 (4H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 3.46 (4H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 2.76 (4H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 2.38 (3H, s), 1.19 (6H, t, $J=7.0\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 609 ($M-1$)

【0877】

化合物 736 4- { [ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 736 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ 8.48 (1H, s), 8.31 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.98 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.81 (2H, dd, $J=6.5\text{Hz}$, $J=6.5\text{Hz}$), 7.64 (1H, s

), 7.42-7.51 (3H, m), 7.10 (2H, dd, J=8.7 Hz, J=8.7 Hz), 3.79 (2H, s), 3.53 (4H, t, J=6.2 Hz), 3.67 (4H, q, J=7.0 Hz), 2.76 (4H, t, J=6.1 Hz), 1.19 (6H, t, J=6.9 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 635 (M+23)

【0878】

化合物 737 4- { [ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 737 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.50 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.30-7.76 (7H, m), 7.11 (1H, ddd, J=2.0 Hz, J=8.3 Hz, J=8.3 Hz), 3.80 (2H, s), 3.53 (4H, t, J=6.2 Hz), 3.47 (4H, q, J=6.2 Hz), 2.76 (4H, t, J=6.2 Hz), 1.19 (6H, t, J=6.9 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 635 (M+23)

【0879】

化合物 738 4- { [ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 738 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.55 (1H, s), 8.24 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.07 (1H, s), 7.95-8.04 (3H, m), 7.62 (1H, s), 7.57 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.50 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.43 (1H, d, J=8.6 Hz), 3.81 (2H, s), 3.53 (4H, t, J=6.1 Hz), 3.47 (4H, q, J=7.0 Hz), 2.76 (4H, t, J=6.0 Hz), 1.19 (6H, t, J=7.1 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 721 (M+23)

【0880】

化合物739 4- { [ビス- (2-エトキシ-エチル) -アミノ] -メチル}
-N- [4-ブロモ-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニ
ル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物739を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 8.53 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.35-8.45 (1H, m), 7.96 (2H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.75 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.67 (1H, s), 7.53 (1H, ddd, $J=1.9\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.42-7.50 (3H, m), 5.92 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.83 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.52 (4H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.46 (4H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.75 (4H, t, $J=5.5\text{ Hz}$), 1.19 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 625 (M-1)

【0881】

化合物740 4- { [ビス- (2-エトキシ-エチル) -アミノ] -メチル}
-N- [4-ブロモ-2- (3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニ
ル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物740を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 8.47 (1H, s), 8.36 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.97 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.68 (1H, s), 7.47 (3H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.37 (1H, s), 7.27-7.34 (2H, m), 6.92-6.98 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.52 (4H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.46 (4H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 2.75 (4H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 1.18 (6H, t, $J=7.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 649 (M+23)

【0882】

化合物741 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物741を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400MHz): δ 8.51 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.41 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.89 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.81 (1H, dd, $J=2.4\text{Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 7.65 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.49 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.29 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 4.29 (1H, t, $J=5.1\text{Hz}$), 3.52 (2H, bs), 3.38-3.46 (2H, m), 2.78 (2H, d, $J=11.0\text{Hz}$), 2.36 (3H, s), 1.92 (2H, t, $J=11.1\text{Hz}$), 1.61 (2H, d, $J=6.1\text{Hz}$), 1.30-1.40 (3H, m), 1.10-1.20 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 ($M-1$)

【0883】

化合物742 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物742を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 400MHz): δ 8.51 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.41 (1H, s), 8.10 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.88 (2H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 7.81 (1H, dd, $J=2.2\text{Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 7.59 (1H, s), 7.53 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.49 (3H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.36 (1H, dd, $J=7.6\text{Hz}$, $J=7.6\text{Hz}$), 7.28 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 4.29 (1H, t, $J=5.1\text{Hz}$), 3.52 (2H, bs), 3.38-3.45 (2H, m), 2.77 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 2.37 (3H, s), 1.92 (2H, t, $J=10.6\text{Hz}$), 1.60 (2H, d,

$J = 6.1 \text{ Hz}$), $1.30 - 1.40$ (3H, m), $1.10 - 1.21$ (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

【0884】

化合物 743 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドロジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 743 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.50 (1H, d, $J = 9.0 \text{ Hz}$), 8.45 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J = 2.4 \text{ Hz}$), 7.88 (2H, d, $J = 8.0 \text{ Hz}$), 7.78-7.85 (3H, m), 7.49 (2H, d, $J = 8.3 \text{ Hz}$), 7.32 (2H, dd, $J = 8.8 \text{ Hz}$, $J = 8.8 \text{ Hz}$), 4.29 (1H, t, $J = 5.1 \text{ Hz}$), 3.52 (2H, bs), 3.38-3.45 (2H, m), 2.77 (2H, d, $J = 11.2 \text{ Hz}$), 1.92 (2H, t, $J = 10.7 \text{ Hz}$), 1.60 (2H, d, $J = 6.1 \text{ Hz}$), $1.30 - 1.40$ (3H, m), $1.10 - 1.20$ (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 581 (M-1)

【0885】

化合物 744 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドロジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 744 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.49 (1H, d, $J = 8.8 \text{ Hz}$), 8.44 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J = 2.2 \text{ Hz}$), 7.88 (2H, d, $J = 8.0 \text{ Hz}$), 7.78-7.84 (1H, m), 7.47-7.63 (5H, m), 7.25-7.35 (1H, m), 4.27 (1H, t, $J = 5.1 \text{ Hz}$), 3.52 (2H, s), 3.35-3.46 (2H, m), 2.77 (2H, d, $J = 11.2 \text{ Hz}$), 1.92 (2H, dd

, $J=11.0\text{ Hz}$, $J=11.0\text{ Hz}$), 1.61 (2H, d, $J=11.7\text{ Hz}$), 1.30-1.40 (3H, m), 1.08-1.22 (2H, m)
質量分析 (ESI-MS) 580 (M-1)、583 (M+1)

【0886】

化合物745 N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物745を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400MHz): δ 8.49 (1H, s), 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.18 (1H, s), 8.05-8.10 (2H, m), 7.88 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.79-7.85 (2H, m), 7.49 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 4.29 (1H, bs), 3.52 (2H, bs), 3.38-3.45 (2H, m), 2.78 (2H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 1.86-2.00 (2H, m), 1.60 (2H, d, $J=12.2\text{ Hz}$), 1.30-1.40 (3H, m), 1.08-1.22 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 667 (M+1)

【0887】

化合物746 N-[4-ブロモ-2-(3-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物746を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400MHz): δ 8.48 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 7.88 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.78-7.83 (1H, m), 7.49 (2H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.39 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.28-7.33 (2H, m), 7.00-7.07 (1H, m), 4.29 (1H, t, $J=5.0\text{ Hz}$), 3.82 (3H, s), 3.52 (2H, bs), 3.37-3.46 (2H, m), 2.77 (2H

, d, $J=10.8\text{ Hz}$), 1.86-1.98 (2H, m), 1.60 (2H, d, $J=12.2\text{ Hz}$), 1.30-1.40 (3H, m), 1.08-1.22 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 593 (M-1)

【0888】

化合物 747 N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-1-フェニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 747 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.51 (1H, s), 8.33 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.65 (1H, bs), 7.58 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.49 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.26-7.43 (7H, m), 3.84 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 3.64-3.78 (6H, m), 3.57 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 2.43-2.60 (3H, m), 2.29-2.40 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 742 (M-1)

【0889】

化合物 748 N-[4-ブロモ-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-1-フェニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 748 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.44 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 8.37 (1H, s), 7.99 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.74 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.69 (1H, s), 7.50 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.34-7.42 (6H, m), 7.26-7.32 (1H, m), 6.91 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.80-3.85 (1H, m), 3.82 (3H, s), 3.60-3.76 (5H, m), 3.50-3.57 (1H, m), 2.40-2.60 (3H, m), 2.28-2

. 34 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 668 (M-1)

【0890】

化合物 749 6-ブロモ-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3-[(3,4-ジメチル-ベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 749 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.89 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.73 (1H, s), 8.57 (1H, s), 8.03 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.40-7.82 (5H, m), 7.10-7.25 (1H, m), 3.91 (2H, s), 3.56-3.70 (1H, m), 3.15-3.27 (2H, m), 2.70-2.85 (6H, m), 2.34 (6H, s), 1.11 (6H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 589 (M+1)

【0891】

化合物 750 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 750 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): δ 8.42 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.38 (1H, s), 7.99 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.70 (1H, s), 7.62 (1H, s), 7.40-7.52 (4H, m), 7.15 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 3.83 (2H, s), 3.56 (1H, tt, $J=6.5$ Hz, $J=6.5$ Hz), 3.12-3.20 (2H, m), 2.65-2.74 (6H, m), 2.28 (3H, s), 2.26 (3H, s), 1.09 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 605 (M-1)

【0892】

化合物 751 6-ブロモ-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-

4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3-[(3-フルオロ-ベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 751 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.90 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.74 (1H, s), 8.59 (1H, s), 8.02 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.42-7.65 (6H, m), 7.21 (1H, dd, $J=1.7$ Hz, $J=8.3$ Hz, $J=8.3$ Hz), 3.89 (2H, s), 3.62 (1H, tt, $J=6.4$ Hz, $J=6.4$ Hz), 3.15-3.23 (2H, m), 2.65-2.80 (6H, m), 1.10 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

【0893】

化合物 752 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 752 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.46 (1H, s), 8.34 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 7.99 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.66 (1H, s), 7.34-7.62 (6H, m), 7.11 (1H, dd, $J=2.0$ Hz, $J=8.3$ Hz, $J=8.3$ Hz), 3.85 (2H, s), 3.57 (1H, tt, $J=6.5$ Hz, $J=6.5$ Hz), 3.12-3.20 (2H, m), 2.64-2.74 (6H, m), 1.10 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 595 (M-1)

【0894】

化合物 753 6-ブromo-3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 753 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 8.88 (1H, d, $J=8.8$ Hz)

8 Hz), 8.75 (1H, s), 8.58 (1H, s), 7.92-8.05 (2H, m), 7.45-7.70 (6H, m), 3.89 (2H, s), 3.54-3.65 (1H, m), 3.12-3.22 (2H, m), 2.65-2.76 (6H, m), 1.10 (6H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 663 (M-1)

【0895】

化合物 754 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 754 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.51 (1H, s), 8.31 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d, $J=7.8$ Hz), 7.65 (1H, s), 7.58 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.47 (3H, d, $J=8.3$ Hz), 3.86 (2H, s), 3.58 (1H, tt, $J=6.3$ Hz, $J=6.3$ Hz), 3.12-3.20 (2H, m), 2.65-2.75 (6H, m), 1.10 (6H, t, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 681 (M+1)

【0896】

化合物 755 6-ブromo-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3-[(4-メトキシ-ベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 755 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.89 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71 (1H, s), 8.58 (1H, s), 8.03 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.79 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.60 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 7.57 (1H, s), 7.49 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.00 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 3.89 (5H, s), 3.62 (1H, tt, $J=6.2$ Hz, $J=6.2$ Hz), 3.15-3.25

(2 H, m), 2.65-2.80 (6 H, m), 1.11 (6 H, t, $J=7.2$ Hz)

【0897】

化合物 756 N-[4-ブロモ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 756 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.46 (1 H, d, $J=8.8$ Hz), 8.37 (1 H, s), 7.98 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 7.67-7.76 (3 H, m), 7.49 (1 H, d, $J=7.6$ Hz), 7.42 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 6.91 (2 H, d, $J=8.8$ Hz), 3.83 (2 H, s), 3.82 (3 H, s), 3.57 (1 H, tt, $J=6.3$ Hz, $J=6.3$ Hz), 3.12-3.20 (2 H, m), 2.65-2.75 (6 H, m), 1.10 (6 H, t, $J=7.2$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 607 (M-1)

【0898】

化合物 757 N-[4-ブロモ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 757 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.35-8.45 (2 H, m), 7.96 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 7.71 (1 H, s), 7.60 (1 H, s), 7.43-7.48 (2 H, m), 7.40 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.17-7.23 (2 H, m), 7.14 (1 H, d, $J=7.8$ Hz), 6.65-6.73 (3 H, m), 3.83 (2 H, s), 3.38 (2 H, t, $J=7.2$ Hz), 2.89 (3 H, s), 2.68 (2 H, t, $J=7.0$ Hz), 2.26 (3 H, s), 2.25 (3 H, s), 1.81 (2 H, tt, $J=7.1$ Hz, $J=7.1$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 626 (M-1), 628 (M+1)

【0899】

化合物758 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物758を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): 8.37-8.44 (2H, m), 7.92-7.79 (2H, m), 7.64-7.72 (3H, m), 7.45 (1H, d, J=8.0Hz), 7.39 (2H, d, J=8.0Hz), 7.16-7.23 (4H, m), 6.65-6.74 (3H, m), 3.82 (2H, s), 3.39 (2H, t, J=7.2Hz), 2.89 (3H, s), 2.67 (2H, t, J=6.8Hz), 2.34 (3H, s), 1.80 (2H, tt, J=7.0Hz, J=7.0Hz)

質量分析 (ESI-MS) 612 (M-1), 614 (M+1)

【0900】

化合物759 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物759を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz): 8.37-8.46 (2H, m), 7.98 (2H, d, J=7.8Hz), 7.81 (2H, bs), 7.66 (1H, s), 7.50 (1H, d, J=8.6Hz), 7.43 (2H, d, J=8.1Hz), 7.19-7.24 (2H, m), 7.11 (2H, dd, J=8.7Hz, J=8.7Hz), 6.66-6.75 (3H, m), 3.84 (2H, s), 3.41 (2H, t, J=7.2Hz), 2.92 (3H, s), 2.69 (2H, t, J=7.0Hz), 1.81 (2H, tt, J=7.0Hz, J=7.0Hz)

質量分析 (ESI-MS) 616 (M-1), 618 (M+1)

【0901】

化合物760 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) -フェニル] -4- { [3- (メチル-フェニル-アミノ) -
プロピルアミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物760を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.45 (1H, bs), 8.34 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.98 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.34-7.67 (7H, m), 7.18-7.25 (2H, m), 7.11 (1H, ddd, $J=1.7\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$, $J=7.6\text{ Hz}$), 6.72 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 6.68 (1H, dd, $J=7.2\text{ Hz}$, $J=7.2\text{ Hz}$), 3.84 (2H, s), 3.41 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.91 (3H, s), 2.68 (2H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.80 (2H, tt, $J=7.0\text{ Hz}$, $J=7.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 614 ($M-1$), 618 ($M+1$)

【0902】

化合物761 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{ [3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物761を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.50 (1H, s), 8.27 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8.06 (1H, s), 7.99 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.63 (1H, bs), 7.56 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.19-7.25 (2H, m), 6.65-6.75 (5H, m), 3.85 (2H, s), 3.41 (2H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.92 (3H, s), 2.69 (2H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.81 (2H, tt, $J=7.0\text{ Hz}$, $J=7.0\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 698, 700 ($M-1$), 702 ($M+1$)

【0903】

化合物762 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{ [3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物762を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): 8.44 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.37 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.65–7.77 (3H, m), 7.48 (1H, d, $J=8.8$ Hz), 7.40 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.19–7.25 (3H, m), 6.90 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 6.71 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.68 (1H, dd, $J=7.2$ Hz, $J=7.2$ Hz), 3.81 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.40 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.91 (3H, s), 2.67 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 1.79 (2H, tt, $J=7.0$ Hz, $J=7.0$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 626 ($M-1$), 630 ($M+1$)

【0904】

化合物763 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物763を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): 8.44 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.40 (1H, s), 7.97 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.71 (1H, s), 7.18–7.54 (8H, m), 6.94–7.00 (1H, m), 6.71 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.68 (1H, dd, $J=7.2$ Hz, $J=7.2$ Hz), 3.84 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.40 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.91 (3H, s), 2.67 (2H, t, $J=6.8$ Hz), 1.80 (2H, tt, $J=7.0$ Hz, $J=7.0$ Hz),

質量分析 (ESI-MS) 626 ($M-1$), 630 ($M+1$)

【0905】

化合物764 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 764 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.37–8.45 (2H, m), 7.98 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.72 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.42–7.50 (4H, m), 7.07–7.20 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.83 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 2.73 (2H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 2.51 (2H, q, $J=7.3\text{Hz}$), 2.26 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.24 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 565 ($M-1$)

【0906】

化合物 765 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 765 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.39–8.45 (2H, m), 7.84–8.02 (2H, m), 7.68 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.42–7.50 (3H, m), 7.15–7.25 (3H, m), 3.88 (2H, s), 2.83 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 2.73 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 2.52 (2H, q, $J=7.4\text{Hz}$), 2.36 (3H, s), 1.25 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 551 ($M-1$)

【0907】

化合物 766 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 766 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44 (1H, s), 8.37 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.99 (2H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.68 (2H, s), 7.54 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.42–7.5

0 (3 H, m), 7.29 (1 H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=7.6$ Hz), 7.22 (1 H, d, $J=7.6$ Hz), 3.87 (2 H, s), 2.81 (2 H, t, $J=6.5$ Hz), 2.72 (2 H, t, $J=6.2$ Hz), 2.53 (2 H, q, $J=7.4$ Hz), 2.37 (3 H, s), 1.26 (3 H, t, $J=7.3$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

【0908】

化合物767 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドロジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物767を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.46 (1 H, s), 8.33 (1 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.98 (2 H, d, $J=7.8$ Hz), 7.80 (2 H, bs), 7.65 (1 H, s), 7.45 (3 H, d, $J=8.0$ Hz), 7.10 (2 H, dd, $J=8.5$ Hz, $J=8.5$ Hz), 3.87 (2 H, s), 2.82 (2 H, t, $J=6.3$ Hz), 2.72 (2 H, t, $J=6.5$ Hz), 2.53 (2 H, q, $J=7.4$ Hz), 1.26 (3 H, t, $J=7.3$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 557 (M-1)

【0909】

化合物768 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドロジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物768を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.46 (1 H, bs), 8.34 (1 H, d, $J=7.8$ Hz), 7.99 (2 H, d, $J=7.6$ Hz), 7.66 (1 H, bs), 7.34-7.60 (6 H, m), 7.11 (1 H, dd, $J=2.4$ Hz, $J=8.3$ Hz, $J=8.3$ Hz), 3.89 (2 H, s), 2.83 (2 H, t, $J=6.4$ Hz), 2.73 (2 H, t, $J=6.$

3 Hz), 2.54 (2H, q, J=7.4 Hz), 1.26 (3H, t, J=7.2 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 555 (M-1)

【0910】

化合物 769 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 769 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.53 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d, J=7.8 Hz), 7.63 (1H, bs), 7.57 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.40-7.50 (3H, m), 3.90 (2H, s), 2.84 (2H, t, J=6.2 Hz), 2.73 (2H, t, J=6.5 Hz), 2.54 (2H, q, J=7.4 Hz), 1.27 (3H, t, J=7.5 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 643 (M-1)

【0911】

化合物 770 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 770 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz): 8.37-8.45 (2H, m), 7.98 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.68-7.74 (3H, m), 7.47 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.42 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.90 (2H, d, J=8.8 Hz), 3.86 (2H, s), 3.81 (3H, s), 2.81 (2H, t, J=6.5 Hz), 2.72 (2H, t, J=6.2 Hz), 2.52 (2H, q, J=7.4 Hz), 1.25 (3H, t, J=7.5 Hz)

質量分析 (ESI-MS) 569 (M-1)

【0912】

化合物 771 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 771 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): 8.45 (1H, s), 8.39 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 7.97 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.73 (1H, bs), 7.40-7.50 (3H, m), 7.34 (1H, s), 7.26-7.30 (2H, m), 6.90-7.00 (1H, m), 3.85 (2H, s), 3.83 (3H, s), 2.81 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 2.71 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 2.53 (2H, q, $J=7.4\text{ Hz}$), 1.25 (3H, t, $J=7.4\text{ Hz}$)

質量分析 (ESI-MS) 567 ($M-1$)

【0913】

化合物 772 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 772 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): δ 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.59 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.64 (2H, bs), 6.62 (2H, m), 7.18 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.59 (7H, m), 8.00 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.18 (1H, m), 8.31 (1H, s), 8.56 (1H, m), 10.08 (1H, bs), 11.68 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 623 ($M-1$)

【0914】

化合物 773 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 773 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 2.39 (3H, s), 2.59 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.64 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.23 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.59 (7H, m), 8.00 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.18 (1H, m), 8.32 (1H, s), 8.60 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 9.90 (1H, bs), 11.70 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 611 (M-1)

【0915】

化合物 774 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 774 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 2.59 (4H, bs), 3.59 (4H, bs), 3.65 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.12 (2H, m), 7.64 (7H, m), 8.00 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.18 (1H, m), 8.37 (1H, bs), 8.60 (1H, m), 10.20 (1H, bs), 11.70 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 613 (M-1)

【0916】

化合物 775 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 775 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400MHz) : δ 2.59 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.65 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.14 (1H, m), 7.50 (8H, m), 8.00 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.18 (1H, m), 8.40 (1H, s), 8.55 (1H, bs), 10.30 (1H, bs), 11.60 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 613 (M-1)

【0917】

化合物776 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物776を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 2.60 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.65 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.54 (6H, m), 8.02 (4H, m), 8.18 (1H, m), 8.47 (2H, bs), 10.45 (1H, bs), 11.50 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 697 (M-1)

【0918】

化合物777 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物777を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 2.59 (4H, bs), 3.61 (6H, m), 3.84 (3H, s), 6.62 (2H, m), 6.93 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.49 (4H, m), 7.72 (3H, m), 7.80 (2H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.18 (1H, m), 8.31 (1H, bs), 8.58 (1H, m), 9.99 (1H, bs), 11.69 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 625 (M-1)

【0919】

化合物778 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物778を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ 2.59 (4H, bs), 3.59 (6H, m), 3.86 (3H, s), 6.63 (2H, m), 6.98 (

1 H, m), 7.32 (3 H, m), 7.54 (4 H, m), 7.72 (1 H, m), 8.00 (2 H, d, $J=7.3$ Hz), 8.18 (1 H, m), 8.34 (1 H, bs), 8.60 (1 H, d, $J=8.8$ Hz)

質量分析 (ESI-MS) 625 (M-1)

【0920】

化合物779 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフエン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物779を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.10 (6 H, m), 2.51 (4 H, m), 3.88 (4 H, m), 7.03 (1 H, d, $J=6.1$ Hz), 7.53 (2 H, m), 7.68 (2 H, d, $J=8.0$ Hz), 7.92 (1 H, d, $J=7.8$ Hz), 8.06 (2 H, m), 8.32 (1 H, bs), 8.39 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 595 (M-1)

【0921】

化合物780 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフエン-2-イル] -ベンズアミド

(実施例8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物780を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 1.10 (6 H, m), 2.51 (4 H, m), 3.88 (7 H, m), 7.00 (3 H, m), 7.53 (2 H, m), 7.68 (1 H, m), 7.80 (2 H, d, $J=8.3$ Hz), 7.93 (1 H, d, $J=7.1$ Hz), 8.06 (1 H, m), 8.31 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 523 (M-1)

【0922】

化合物781 2- {3- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-2-イルカルバモイル] -ベンジル

スルファニル} - エタンスルフォニック アシッド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 781 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.30 (6H, m), 2.47 (3H, s), 2.79 (2H, m), 2.98 (2H, m), 3.85 (2H, bs), 6.71 (1H, m), 7.18 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.20-8.00 (6H, m), 8.23 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

【0923】

化合物 782 2- {3- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフエン-2-イルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 782 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.39 (3H, s), 2.47 (3H, s), 2.79 (2H, m), 2.99 (2H, m), 3.84 (2H, s), 6.72 (1H, m), 7.20-7.94 (8H, m), 8.26 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

【0924】

化合物 783 2- {3- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-2-イルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 783 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400MHz) : δ 2.47 (3H, bs), 2.80 (2H, m), 2.99 (2H, m), 3.84 (2H, bs), 6.72 (1H, m), 7.14 (2H, m), 7.49 (1H, m), 7.61 (1H, m), 7.92 (4H, m), 8.29 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1)

【0925】

化合物 784 2- {3- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベン

ジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチル-チオフェン-2-イルカルバモイル] - ベンジルスルファニル} - エタンスルフォニック アシッド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 784 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 2.47 (3H, bs), 2.79 (2H, m), 2.98 (2H, m), 3.84 (2H, bs), 6.70 (1H, m), 7.40-8.02 (6H, m), 8.31 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 618 (M-1)

【0926】

化合物 785 2- {3- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチル-チオフェン-2-イルカルバモイル] - ベンジルスルファニル} - エタンスルフォニック アシッド

(実施例 8) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 785 を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD , 400 MHz) : δ 2.47 (3H, bs), 2.81 (2H, m), 2.98 (2H, m), 3.84 (5H, m), 6.71 (1H, m), 6.97 (2H, m), 7.44-7.98 (6H, m), 8.24 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

化合物 1 ~ 785 の原料化合物を示すと下記の通りである。表中化合物 A、B、C、および B' は実施例 1 ~ 7 において示された化合物に対応する。

【表1】

	A	B	C	B'
化合物1	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	トランス-シンナムアルデヒド	
化合物2	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-フルオロベンズアルデヒド	
化合物3	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物4	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	o-メトキシベンズアルデヒド	
化合物5	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	
化合物6	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 5-ジtert-ブチル-4-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物7	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	アルファ-メチルシンナムアルデヒド	
化合物8	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 5-ジトリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物9	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-シアノベンズアルデヒド	
化合物10	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-ブロムベンズアルデヒド	
化合物11	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	バニリン	
化合物12	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4, 5-トリメトキシベンズアルデヒド	
化合物13	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	トランス-シンナムアルデヒド	
化合物14	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-ブロムベンズアルデヒド	

化合物15	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物16	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物17	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	ベンズアルデヒド	
化合物18	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-ヒドロキシベンズアル デヒド	
化合物19	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-ヒドロキシベンズアル デヒド	
化合物20	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物21	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	フルフラール	
化合物22	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	5-メチルフルフラール	
化合物23	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	2-チオフェンカルボキ シアルデヒド	
化合物24	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-チオフェンカルボキ シアルデヒド	
化合物25	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	2, 4-ジヒドロキシベン ズアルデヒド	
化合物26	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3, 4-ジヒドロキシベン ズアルデヒド	
化合物27	メチル 2-アミノベンゾ エート	2-フルオロベンゾイル クロライド	ベンズアルデヒド	
化合物28	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	2-フルオロベンズアル デヒド	

化合物29	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物30	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物31	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物32	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-クロロ-4-フルオロ ベンズアルデヒド	
化合物33	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-トリフルオロメトキシ ベンズアルデヒド	
化合物34	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-プロモ-4-メトキシ ベンズアルデヒド	
化合物35	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-クロロベンズアルデ ヒド	
化合物36	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3, 5-ジメチル-4-ヒ ドロキシベンズアルデヒド	
化合物37	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-エトキシ-4-ヒドロ キシベンズアルデヒド	
化合物38	メチル 2-アミノベンゾ エート	2-フルオロベンゾイル クロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物39	メチル 2-アミノベンゾ エート	2-フルオロベンゾイル クロライド	3-ヒドロキシベンズア ルデヒド	
化合物40	メチル 2-アミノベンゾ エート	2-フルオロベンゾイル クロライド	p-トルアルデヒド	
化合物41	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物42	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-ヒドロキシ-3-メチ ルベンズアルデヒド	

化合物43	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2, 5-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物44	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-フルオロ-5-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物45	メチル 2-アミノベンゾエート	2-フルオロベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシ-3-メチルベンズアルデヒド	
化合物46	メチル 2-アミノベンゾエート	2-フルオロベンゾイルクロライド	2, 5-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物47	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物48	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物49	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物50	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物51	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物52	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-アリロキシベンズアルデヒド	
化合物53	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 5-ジメトキシベンズアルデヒド	
化合物54	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ベンズアルデヒド	
化合物55	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物56	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	

化合物57	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物58	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物59	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-クロロベンズアルデヒド	
化合物60	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロベンズアルデヒド	
化合物61	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物62	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物63	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物64	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物65	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物66	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物67	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物68	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物69	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物70	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	

化合物71	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物72	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物73	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物74	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物75	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物76	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物77	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物78	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物79	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物80	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物81	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物82	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物83	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物84	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	

化合物85	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物86	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物87	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物88	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物89	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物90	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物91	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物92	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物93	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物94	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物95	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物96	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物97	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキシベンズアルデヒド	
化合物98	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキシベンズアルデヒド	

化合物99	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキシベンズアルデヒド	
化合物100	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキシベンズアルデヒド	
化合物101	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキシベンズアルデヒド	
化合物102	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキシベンズアルデヒド	
化合物103	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ニトロベンズアルデヒド	
化合物104	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ジメチルアミノベンズアルデヒド	
化合物105	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物106	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物107	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-クロロベンズアルデヒド	
化合物108	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	4-クロロベンズアルデヒド	
化合物109	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物110	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ピリジンカルボキシアリデヒド	
化合物111	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ピリジンカルボキシアリデヒド	
化合物112	メチル 2-アミノベンゾエート	4-メトキシベンゾイルクロライド	3-ピリジンカルボキシアリデヒド	

化合物113	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-ピリジニカルボキシャルデヒド	
化合物114	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物115	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物116	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-クロロベンズアルデヒド	
化合物117	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロベンズアルデヒド	
化合物118	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物119	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物120	メチル 2-アミノベンゾエート	3-トリフルオロメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物121	メチル 2-アミノベンゾエート	3-トリフルオロメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物122	メチル 2-アミノベンゾエート	3-トリフルオロメトキシベンゾイルクロライド	3-クロロベンズアルデヒド	
化合物123	メチル 2-アミノベンゾエート	3-トリフルオロメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロベンズアルデヒド	
化合物124	メチル 2-アミノベンゾエート	3-トリフルオロメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物125	メチル 2-アミノ-5-ヒドロキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物126	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメトキシベンズアルデヒド	

化合物127	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメトキシベンズ アルデヒド	
化合物128	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメトキシベンズ アルデヒド	
化合物129	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物130	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物131	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物132	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物133	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	
化合物134	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物135	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物136	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物137	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物138	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	
化合物139	メチル 2-アミノ-5- ヒドロキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物140	メチル 2-アミノ-5- ヒドロキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	

化合物141	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド		
化合物142	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド		
化合物143	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド		
化合物144	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド		
化合物145	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド		
化合物146	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド		
化合物147	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド		
化合物148	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド		
化合物149	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド		
化合物150	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド		
化合物151	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド		
化合物152	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド		
化合物153	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	m-トルアルデヒド		
化合物154	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	p-トルアルデヒド		

化合物155	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物156	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物157	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	チオフェン-2-カルボ ニルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物158	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	チオフェン-2-カルボ ニルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物159	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	チオフェン-2-カルボ ニルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物160	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	チオフェン-2-カルボ ニルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物161	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	チオフェン-2-カルボ ニルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物162	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	チオフェン-2-カルボ ニルクロライド	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物163	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物164	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物165	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物166	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物167	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物168	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	

化合物169	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物170	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物171	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物172	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物173	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物174	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物175	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物176	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物177	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物178	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	4-エチルベンゾイルク ロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物179	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	4-エチルベンゾイルク ロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物180	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	4-エチルベンゾイルク ロライド	m-トルアルデヒド	
化合物181	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	4-エチルベンゾイルク ロライド	p-トルアルデヒド	
化合物182	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	4-エチルベンゾイルク ロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	

化合物183	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	4-エチルベンゾイルク ロライド	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物184	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物185	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物186	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物187	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物188	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	
化合物189	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物190	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物191	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物192	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物193	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	
化合物194	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物195	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	4-メルカプトピリジン
化合物196	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	4-メルカプトピリジン

化合物197	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物198	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物199	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	4-メルカプトピリジン
化合物200	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	4-メルカプトピリジン
化合物201	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	1-メチルピロール-2- カルボキサルデヒド	
化合物202	メチル 2-アミノ-5- ブロモベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物203	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物204	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物205	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物206	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物207	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物208	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物209	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフル オロメチルベンズアルデ ヒド	
化合物210	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	1-メチルピロール-2- カルボキサルデヒド	

化合物211	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	1-メチルピロール-2- カルボキサルデヒド	
化合物212	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	1-メチルピロール-2- カルボキサルデヒド	
化合物213	メチル 2-アミノベンゾ エート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-フルオロアセトフェノ ン	
化合物214	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾ イルクロライド	3-フルオロアセトフェノ ン	
化合物215	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-メチルアセトフェノン	
化合物216	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-メチルアセトフェノン	
化合物217	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-メチルアセトフェノン	
化合物218	メチル 2-アミノベンゾ エート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物219	メチル 2-アミノベンゾ エート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物220	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物221	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物222	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物223	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フラ ンカルボキサルデヒド	
化合物224	メチル 2-アミノベンゾ エート	ベンゾイルクロライド	ベンズアルデヒド	

化合物225	メチル 2-アミノベンゾエート	ベンゾイルクロライド	2-フルオロベンズアルデヒド	
化合物226	メチル 2-アミノベンゾエート	ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物227	メチル 2-アミノ-3, 4-ジメトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	ベンズアルデヒド	
化合物228	メチル 2-アミノベンゾエート	ベンゾイルクロライド	2-ブロモベンズアルデヒド	
化合物229	メチル 2-アミノベンゾエート	ベンゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物230	メチル 2-アミノ-3, 4-ジメトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物231	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-クロロベンズアルデヒド	
化合物232	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	6-メトキシ-2-ナフタルデヒド	
化合物233	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ビフェニルカルボキサルデヒド	
化合物234	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ブロモベンズアルデヒド	
化合物235	メチル 2-アミノベンゾエート	ベンゾイルクロライド	トランス-シナムアルデヒド	
化合物236	メチル 2-アミノベンゾエート	2-フルオロベンゾイルクロライド	2-フルオロベンズアルデヒド	
化合物237	メチル 2-アミノベンゾエート	2-フルオロベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物238	メチル 2-アミノベンゾエート	2-フルオロベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	

化合物239	メチル 2-アミノベンゾエート	2-フルオロベンゾイルクロライド	2-ヒドロキシ-3-tert-ブチルベンズアルデヒド	
化合物240	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ニトロベンズアルデヒド	
化合物241	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-ジエチルアミノベンズアルデヒド	
化合物242	メチル 2-アミノ-5-ヒドロキシベンゾエート	3, 5-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物243	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-ピリジルカルボキサルデヒド	
化合物244	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-ピリジルカルボキサルデヒド	
化合物245	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	2-ピリジルカルボキサルデヒド	
化合物246	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	6-メチル-2-ピリジンカルボキサルデヒド	
化合物247	メチル 2-アミノベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	6-メチル-2-ピリジンカルボキサルデヒド	
化合物248	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-tert-ブチルベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物249	メチル 2-アミノベンゾエート	イソニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-メチルアセトフェノン	
化合物250	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-メチルアセトフェノン	
化合物251	メチル 2-アミノベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-メチルアセトフェノン	
化合物252	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	

化合物253	メチル 2-アミノベンゾエート	イソニコチノイル クロライド 塩酸塩	m-トルアルデヒド		
欠番					
化合物255	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-	メルカプトピリジン
化合物256	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-	メルカプトピリジン
化合物257	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-	メルカプトピリジン
化合物258	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-	メルカプトピリジン
化合物259	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-	メルカプトピリジン
化合物260	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-	メルカプトピリジン
化合物261	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-	メルカプトエタノール
化合物262	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-	メルカプトエタノール
化合物263	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-	メルカプトエタノール
化合物264	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-	メルカプトエタノール
化合物265	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-	メルカプトエタノール
化合物266	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-	メルカプトエタノール

	A	B	C	B'
化合物267	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物268	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物269	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物270	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物271	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物272	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物273	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物274	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物275	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物276	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物277	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物278	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物279	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物280	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン

化合物281	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物282	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物283	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物284	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物285	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物286	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物287	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物288	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物289	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物290	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物291	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物292	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物293	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物294	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン

化合物295	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物296	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物297	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物298	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物299	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物300	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)ジエタノールアミン
化合物301	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)ジエタノールアミン
化合物302	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)ジエタノールアミン
化合物303	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物304	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物305	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)アセチル)-モルホリン
化合物306	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)アセチル)-モルホリン
化合物307	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)アセチル)-モルホリン
化合物308	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

化合物309	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物310	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物311	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物312	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物313	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物314	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物315	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物316	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	3,4-ジクロロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物317	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物318	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	m-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物319	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物320	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物321	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物322	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	ベンゾ	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン

化合物323	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物324	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物325	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物326	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物327	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物328	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物329	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物330	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物331	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物332	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物333	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物334	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物335	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物336	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール

化合物337	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物338	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物339	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物340	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3,4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物341	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1,2,4-トリアゾール
化合物342	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3,4-ジメチルベンズアルデヒド	N,N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物343	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N,N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物344	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N,N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物345	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3,4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物346	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナムアルデヒド	
化合物347	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナムアルデヒド	
化合物348	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナムアルデヒド	
化合物349	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナムアルデヒド	
化合物350	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒド	

化合物351	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒド	
化合物352	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物353	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物354	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物355	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物356	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物357	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-フルオロベンゼンチオール
化合物358	メチル 2-アミノベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	4-ジメチルアミノシナナムアルデヒド	
化合物359	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物360	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物361	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物362	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物363	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物364	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	

欠番					
化合物366	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-メルカプトピペリジン	
化合物367	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド		
化合物368	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物369	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物370	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物371	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物372	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物373	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物374	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物375	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物376	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物377	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	
化合物378	メチル 2-アミノ-5-クロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン	

化合物379	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物380	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物381	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物382	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物383	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物384	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物385	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物386	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物387	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物388	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物389	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物390	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物391	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物392	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール

化合物393	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物394	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物395	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物396	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物397	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物398	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物399	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物400	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物401	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物402	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物403	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物404	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物405	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物406	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジエタノールアミン

化合物407	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物408	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物409	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物410	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物411	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物412	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物413	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物414	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物415	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物416	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物417	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物418	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物419	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物420	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール

化合物421	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	4-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-ヒドロキシベンズアル デヒド	2-(メチルアミノ)エタ ノール
化合物422	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物423	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物424	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物425	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物426	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物427	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物428	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-メトキシベンズアルデ ヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物429	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-メトキシベンズアルデ ヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物430	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-ヒドロキシベンズアル デヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物431	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-ヒドロキシベンズアル デヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物432	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	4-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物433	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	4-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール
化合物434	メチル 2-アミノ クロベンゾエート	5-クロ	4-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタ ノール

化合物435	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物436	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物437	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物438	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物439	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物440	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物441	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物442	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物443	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物444	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物445	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物446	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物447	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物448	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩

化合物449	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物450	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物451	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物452	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物453	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物454	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物455	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物456	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物457	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物458	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物459	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物460	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物461	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物462	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール

化合物463	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物464	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物465	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物466	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物467	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物468	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物469	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物470	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物471	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物472	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物473	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物474	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物475	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物476	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン

化合物477	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物478	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-メトキシベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物479	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-メトキシベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物480	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-ヒドロキシベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物481	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-ヒドロキシベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物482	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物483	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物484	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物485	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物486	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物487	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物488	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-メトキシベンズアルデ ヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物489	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-メトキシベンズアルデ ヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物490	メチル 2-アミノ-5- ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-ヒドロキシベンズアル デヒド	4-ピペリジノピペリジン

化合物491	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物492	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物493	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物494	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-メチルベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物495	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物496	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物497	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物498	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物499	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物500	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物501	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物502	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物503	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物504	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	

化合物505	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物506	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物507	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物508	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物509	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	シクロヘキサンカルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物510	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物511	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物512	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物513	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物514	メチル 2-アミノベンゾエート	2, 5-ジメチルフラン-3-カルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物515	メチル 2-アミノベンゾエート	2, 5-ジメチルフラン-3-カルボニルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物516	メチル 2-アミノベンゾエート	2, 5-ジメチルフラン-3-カルボニルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物517	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物518	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	

化合物519	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	
欠番				
化合物521	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	
化合物522	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	
化合物523	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4 -トリアゾール
化合物524	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1, 2, 4 -トリアゾール
化合物525	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	3-メルカプト-1-プロ パノール
化合物526	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロ パノール
化合物527	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1-プロ パノール
化合物528	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物529	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物530	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物531	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物532	メチル 3-アミノ-4-メ チルチオフェン-2-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチ ル)ピペラジン

化合物533	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物534	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物535	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物536	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物537	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物538	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物539	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物540	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物541	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物542	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物543	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物544	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物545	メチル 2-アミノベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物546	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール

化合物547	メチル 2-アミノ-5-クロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物548	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメチルベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物549	メチル 2-アミノ-5-クロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物550	メチル 2-アミノ-5-クロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物551	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物552	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物553	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物554	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物555	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物556	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物557	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物558	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物559	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物560	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール

	A	B	C	B'
化合物561	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物562	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物563	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物564	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物565	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物566	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物567	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物568	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物569	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物570	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物571	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物572	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物573	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物574	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

化合物575	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物576	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物577	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物578	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物579	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物580	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物581	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物582	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物583	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物584	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物585	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物586	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物587	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物588	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物589	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン

化合物590	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物591	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物592	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物593	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物594	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物595	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物596	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物597	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物598	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物599	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物600	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物601	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物602	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物603	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物604	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール

化合物605	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物606	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物607	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物608	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物609	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物610	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物611	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物612	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物613	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物614	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物615	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

化合物616	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物617	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物618	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物619	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物620	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物621	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物622	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物623	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物624	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物625	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物626	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール

化合物627	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物628	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物629	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物630	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物631	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物632	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物633	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシベリジン
化合物634	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシベリジン
化合物635	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシベリジン
化合物636	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシベリジン
化合物637	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシベリジン

化合物638	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物639	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物640	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物641	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物642	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物643	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物644	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物645	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物646	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物647	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物648	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール

化合物649	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物650	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物651	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物652	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物653	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物654	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物655	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物656	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物657	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物658	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物659	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物660	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール

化合物661	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	3-メルカプト-1-プロ パノール
化合物662	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズアル デヒド	3-メルカプト-1-プロ パノール
化合物663	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-メトキシベンズアル デヒド	3-メルカプト-1-プロ パノール
化合物664	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	N, N-ジエチル-N'- メチルエチレンジアミ ン
化合物665	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'- メチルエチレンジアミ ン
化合物666	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'- メチルエチレンジアミ ン
化合物667	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'- メチルエチレンジアミ ン
化合物668	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'- メチルエチレンジアミ ン
化合物669	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-メトキシベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'- メチルエチレンジアミ ン
化合物670	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	ジイソプロパノールアミ ン
化合物671	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミ ン
化合物672	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミ ン

化合物673	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物674	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物675	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物676	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物677	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物678	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物679	メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物680	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物681	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物682	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物683	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物684	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 3-プロパンジアミン
化合物685	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 3-プロパンジアミン
化合物686	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン

	A	B	C	B'
化合物687	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカブタン
化合物688	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカブタン
化合物689	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカブタン
化合物690	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6-ヘキサンジアミン
化合物691	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物692	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物693	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物694	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物695	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物696	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物697	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物698	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物699	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	フルフリル メルカブタン
化合物700	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカブタン

化合物701	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 3-プロパンジアミン
化合物702	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 3-プロパンジアミン
化合物703	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド ナトリウム塩
化合物704	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6-ヘキサンジアミン
化合物705	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6-ヘキサンジアミン
化合物706	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6-ヘキサンジアミン
化合物707	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物708	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド ナトリウム塩
化合物709	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド ナトリウム塩
化合物710	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物711	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物712	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物713	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物714	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物715	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン

化合物716	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物717	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(4-フルオロフェニル)ピペラジン
化合物718	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物719	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物720	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物721	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物722	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物723	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物724	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物725	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物726	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物727	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物728	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物729	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物730	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン

化合物731	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物732	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物733	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物734	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物735	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物736	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物737	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物738	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物739	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物740	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物741	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物742	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物743	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物744	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物745	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール

化合物746	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ビペリジンエタノール
化合物747	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-モルホリン-4-イル-1-フェニルエチルアミン
化合物748	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-モルホリン-4-イル-1-フェニルエチルアミン
化合物749	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物750	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物751	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物752	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物753	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物754	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物755	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物756	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物757	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物758	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物759	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物760	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン

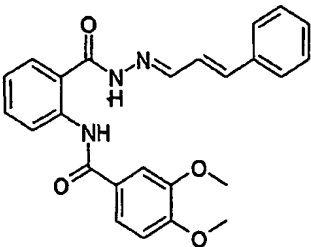
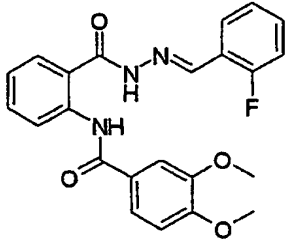
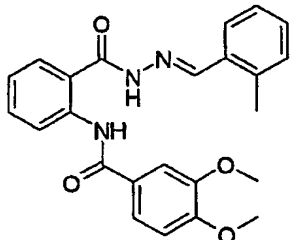
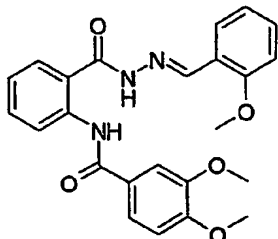
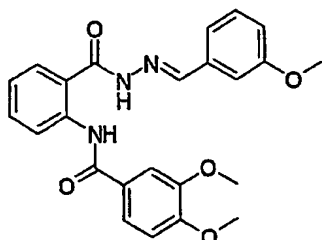
化合物761	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物762	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物763	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物764	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物765	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物766	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物767	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物768	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物769	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物770	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン

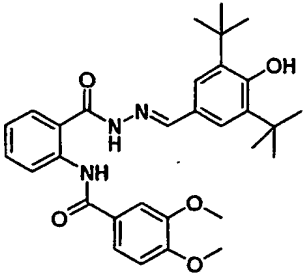
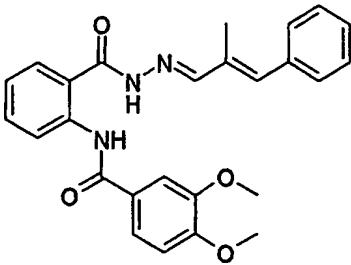
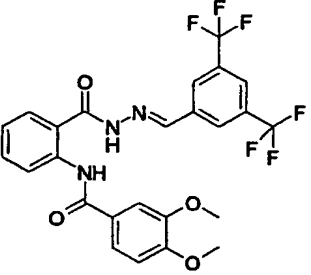
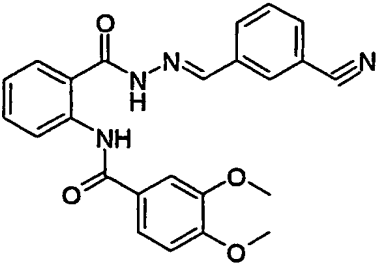
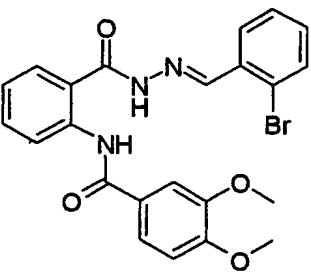
化合物771	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物772	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物773	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物774	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物775	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物776	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物777	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物778	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物779	エチル 2-アミノチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物780	エチル 2-アミノチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物781	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド
化合物782	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド
化合物783	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド
化合物784	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド
化合物785	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホンニックアシッド

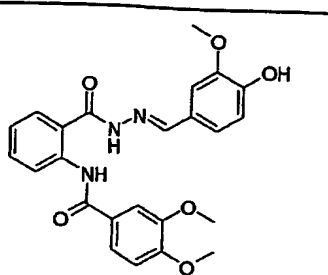
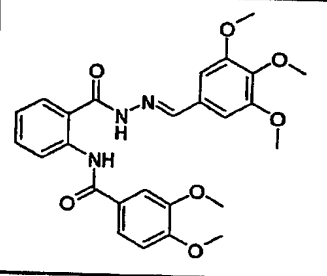
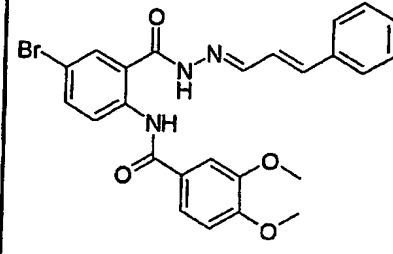
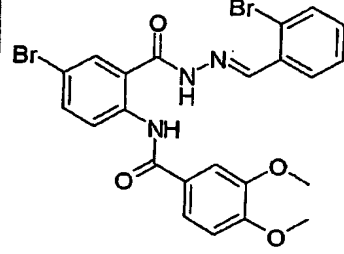
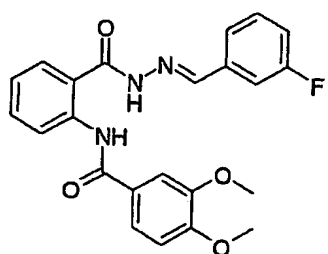
化合物 1 ~ 785 の構造を示すと下記の通りである。

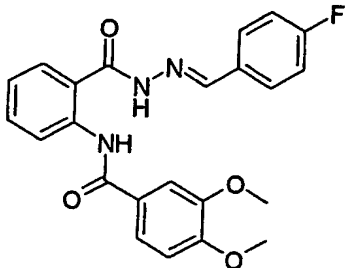
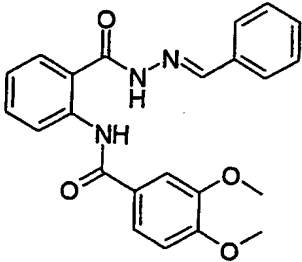
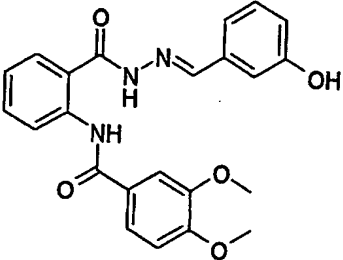
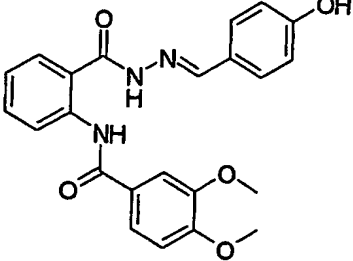
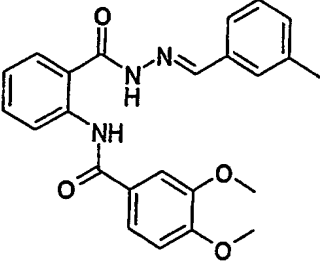
【0927】

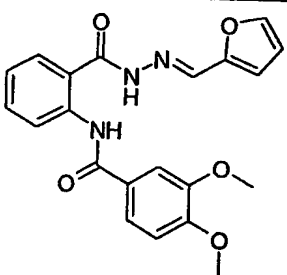
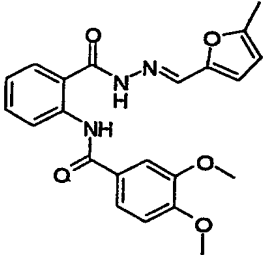
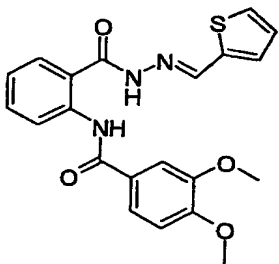
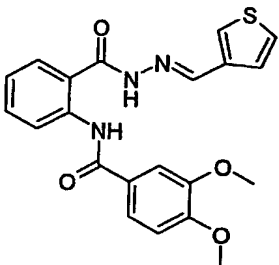
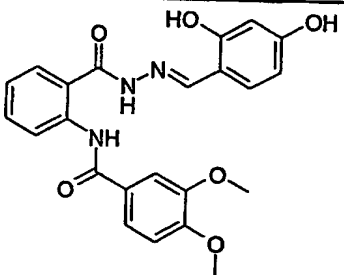
【表 2】

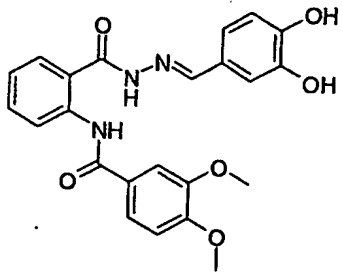
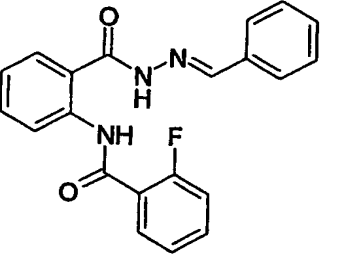
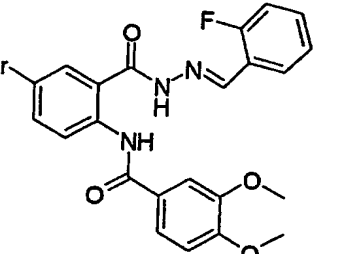
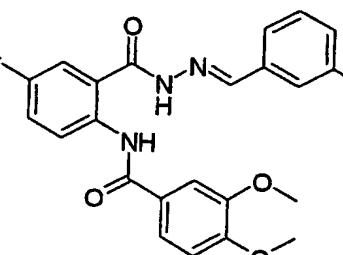
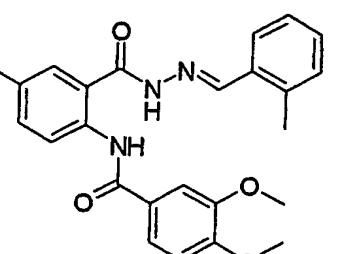
化合物番号	化学構造式
化合物1	
化合物2	
化合物3	
化合物4	
化合物5	

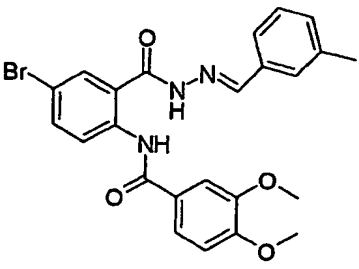
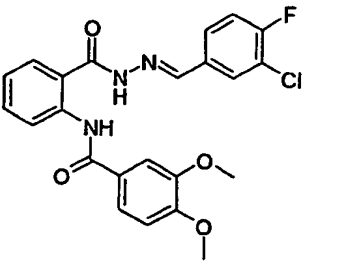
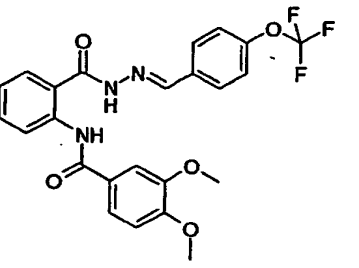
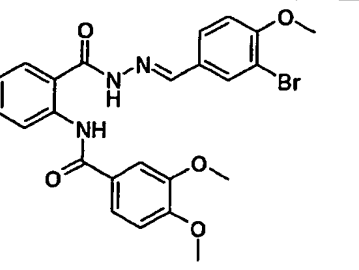
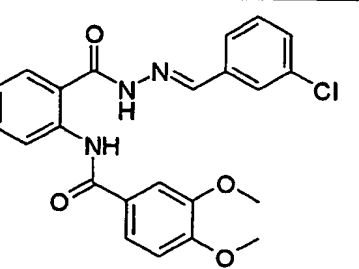
化合物6	
化合物7	
化合物8	
化合物9	
化合物10	

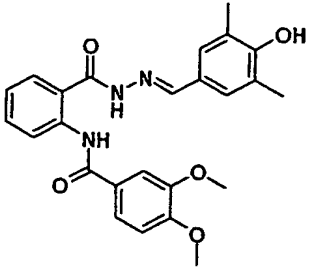
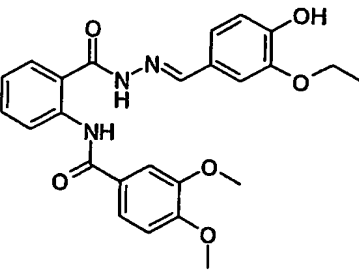
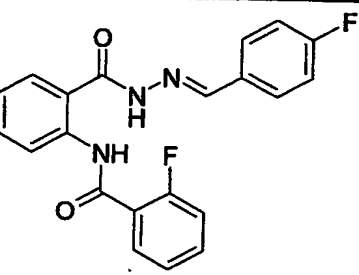
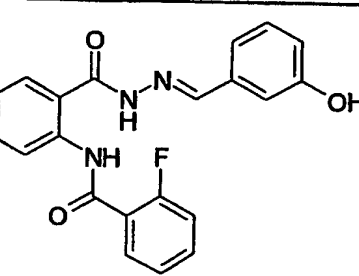
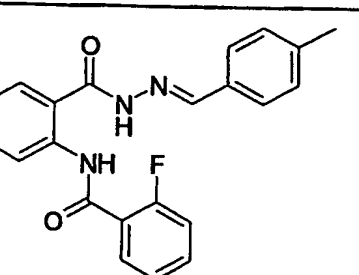
化合物11	
化合物12	
化合物13	
化合物14	
化合物15	

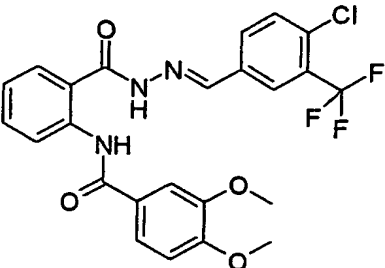
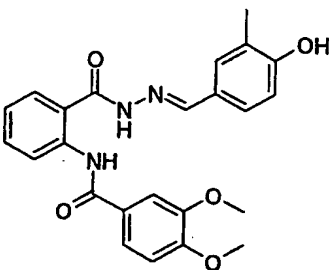
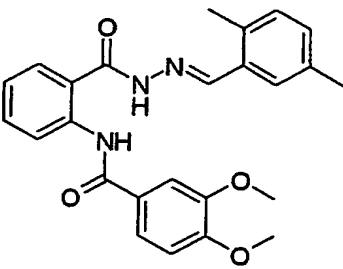
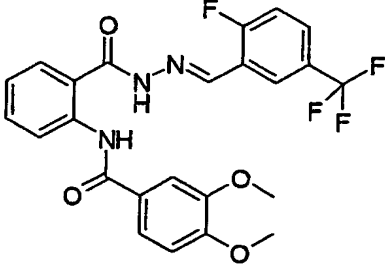
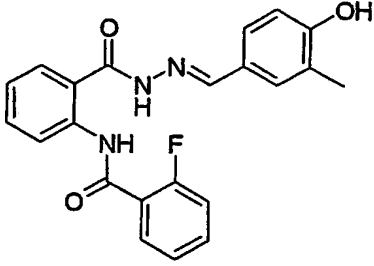
化合物16	
化合物17	
化合物18	
化合物19	
化合物20	

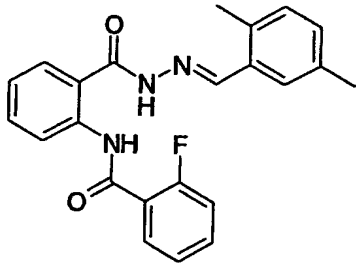
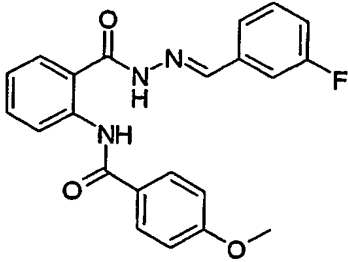
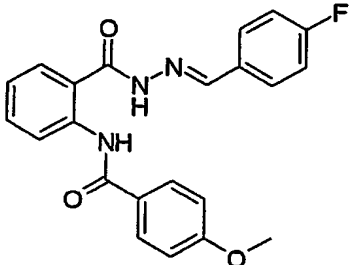
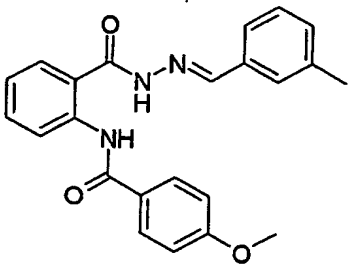
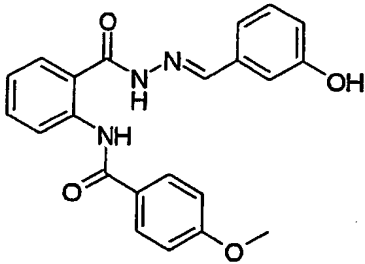
化合物21	
化合物22	
化合物23	
化合物24	
化合物25	

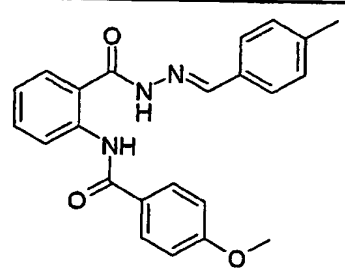
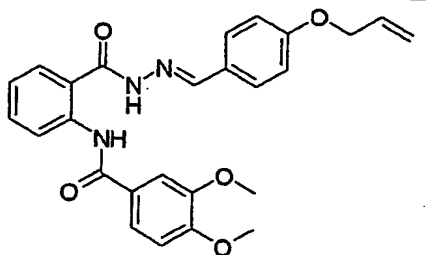
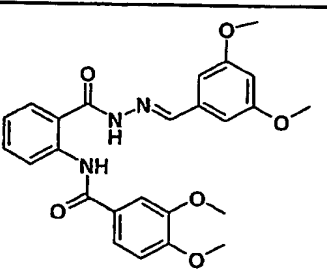
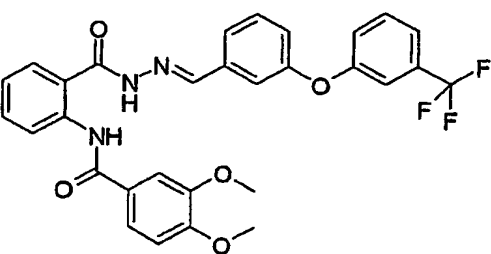
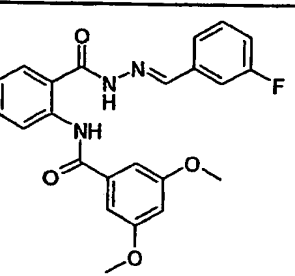
化合物26	
化合物27	
化合物28	
化合物29	
化合物30	

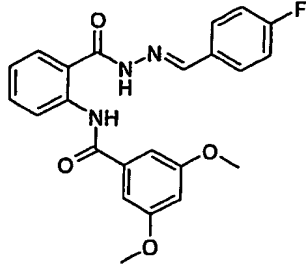
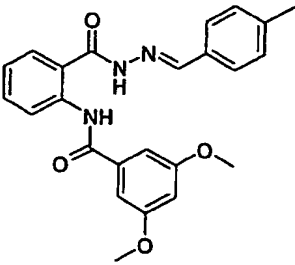
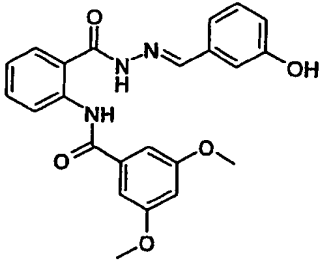
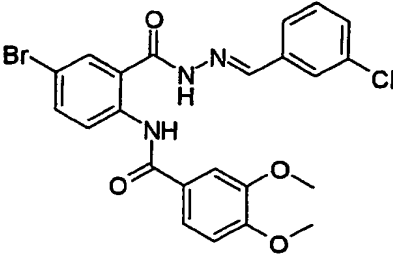
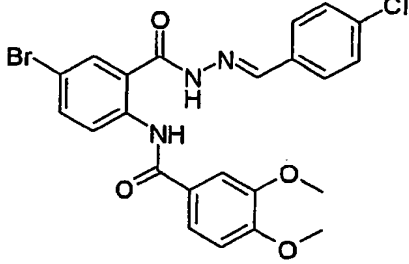
化合物31	
化合物32	
化合物33	
化合物34	
化合物35	

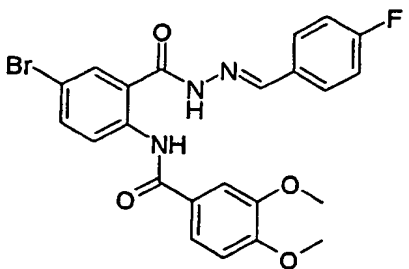
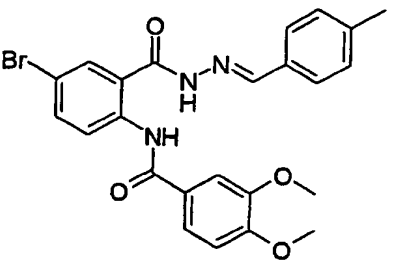
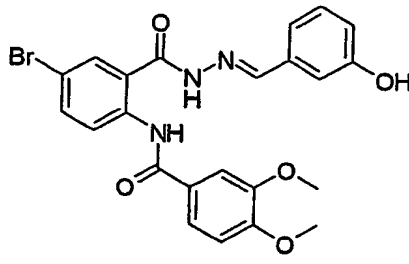
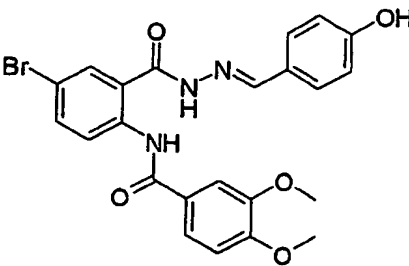
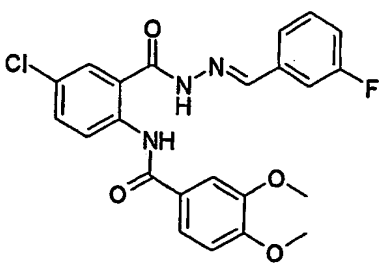
化合物36	
化合物37	
化合物38	
化合物39	
化合物40	

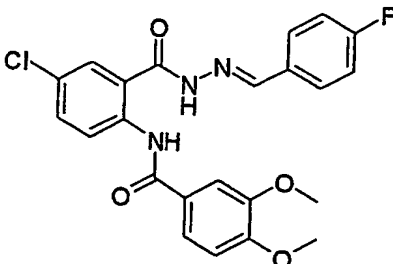
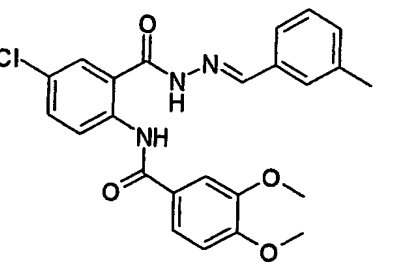
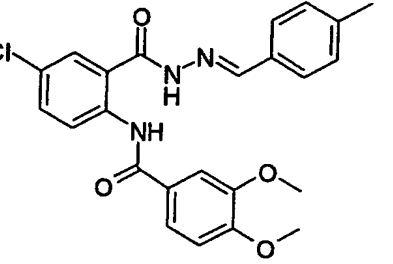
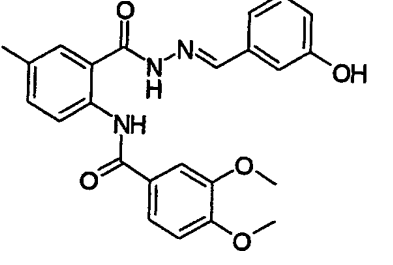
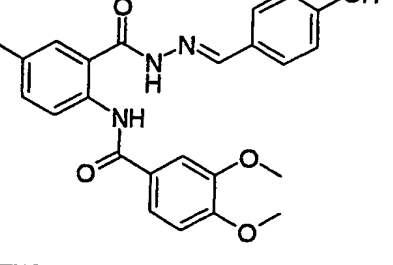
化合物41	
化合物42	
化合物43	
化合物44	
化合物45	

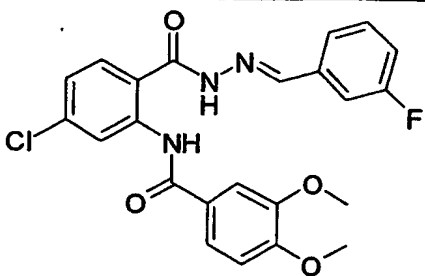
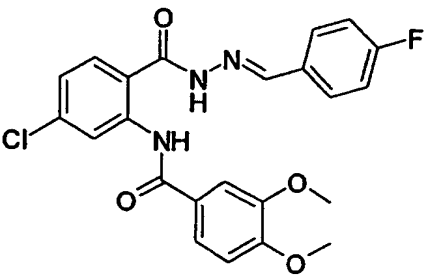
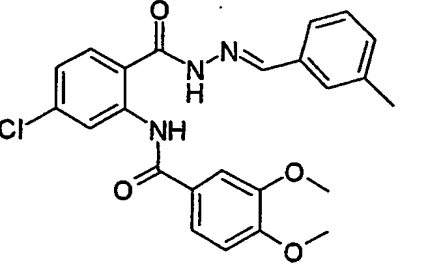
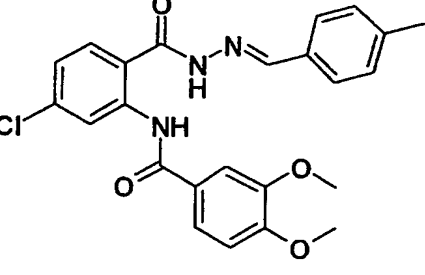
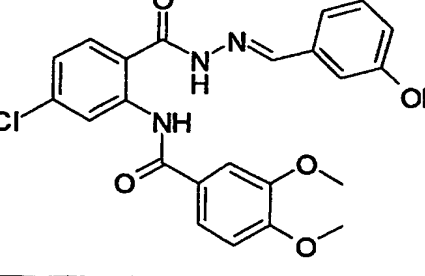
化合物46	
化合物47	
化合物48	
化合物49	
化合物50	

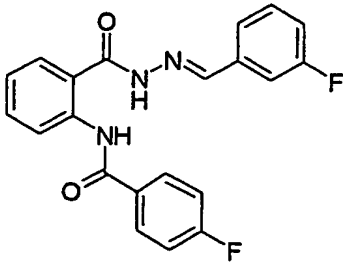
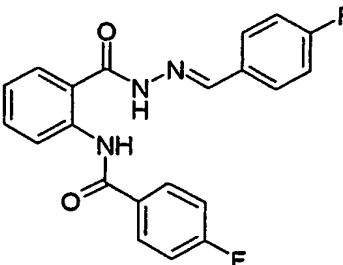
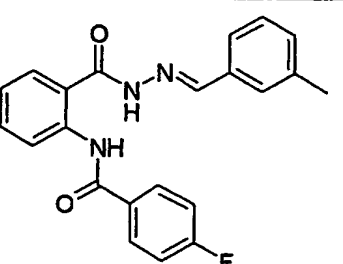
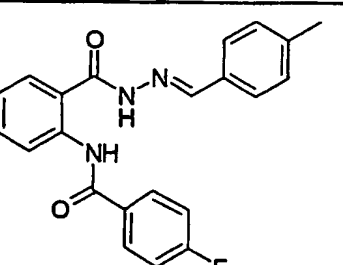
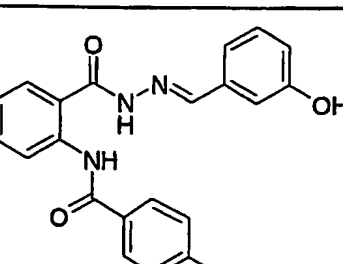
化合物51	
化合物52	
化合物53	
化合物54	
化合物55	

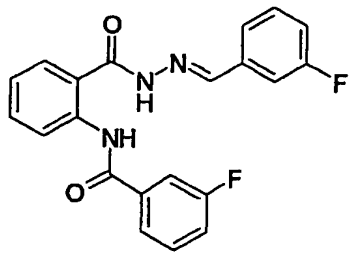
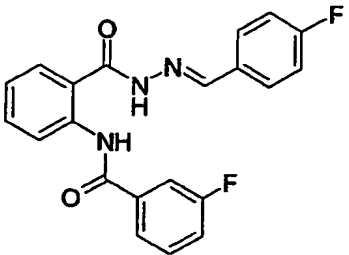
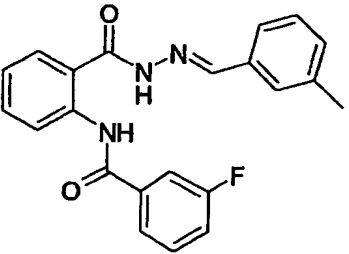
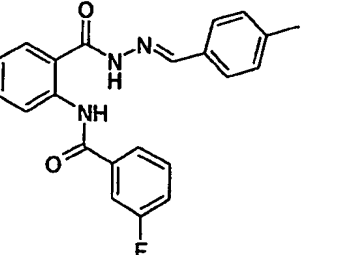
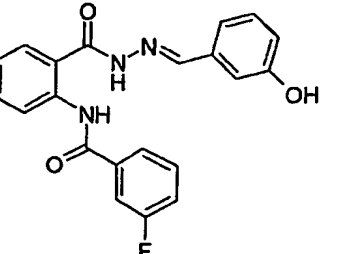
化合物56	
化合物57	
化合物58	
化合物59	
化合物60	

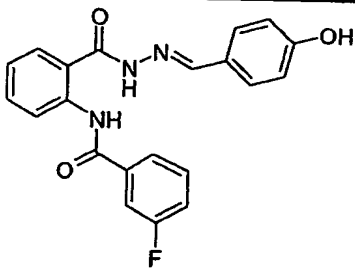
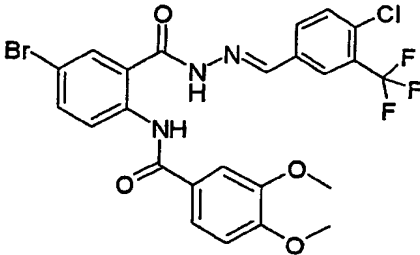
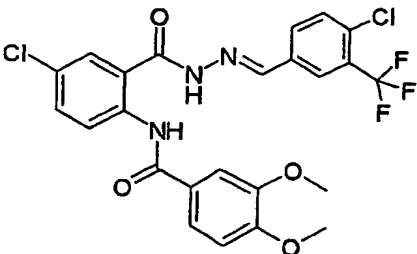
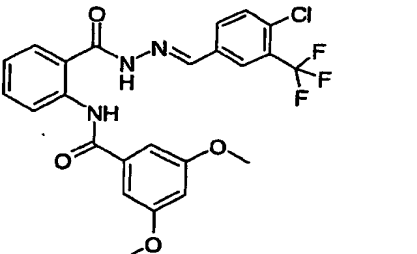
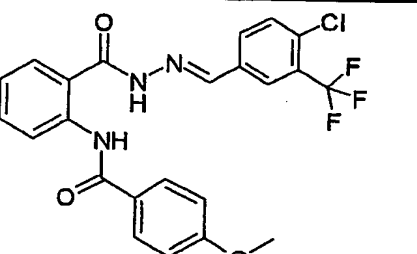
化合物61	 <chem>COc1ccc(cc1OC)C(=O)Nc2cc(Br)ccc2C(=O)NN=Cc3ccc(F)cc3</chem>
化合物62	 <chem>COc1ccc(cc1OC)C(=O)Nc2cc(Br)ccc2C(=O)NN=Cc3ccc(C)cc3</chem>
化合物63	 <chem>COc1ccc(cc1OC)C(=O)Nc2cc(Br)ccc2C(=O)NN=Cc3ccc(O)cc3</chem>
化合物64	 <chem>COc1ccc(cc1OC)C(=O)Nc2cc(Br)ccc2C(=O)NN=Cc3ccc(O)cc3</chem>
化合物65	 <chem>COc1ccc(cc1OC)C(=O)Nc2cc(Cl)ccc2C(=O)NN=Cc3ccc(F)cc3</chem>

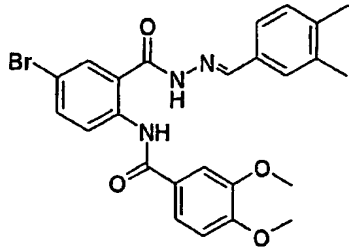
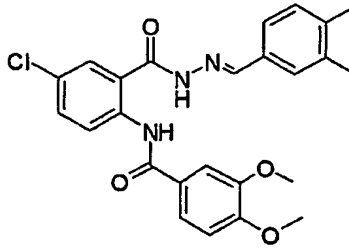
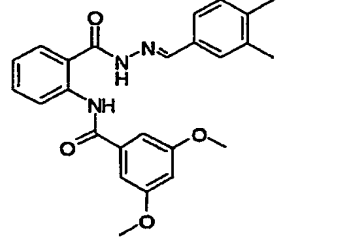
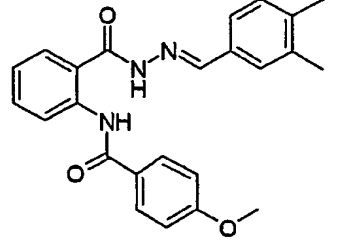
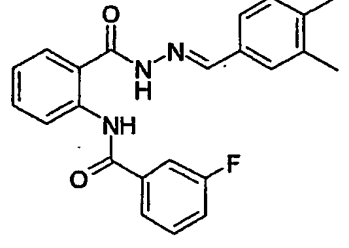
化合物66	
化合物67	
化合物68	
化合物69	
化合物70	

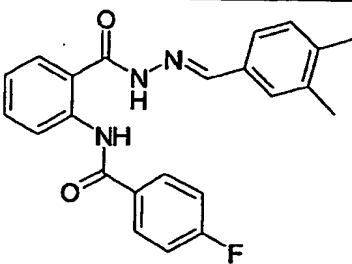
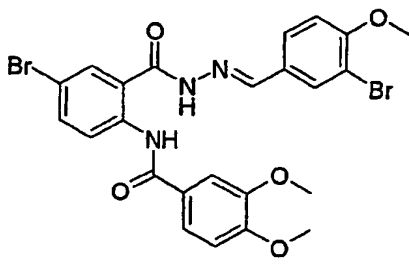
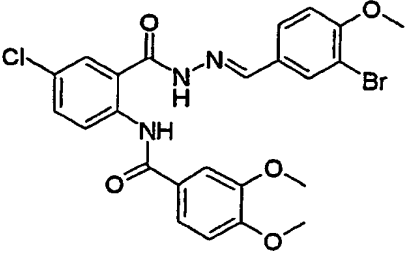
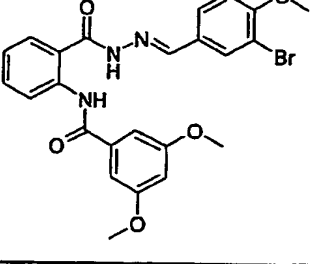
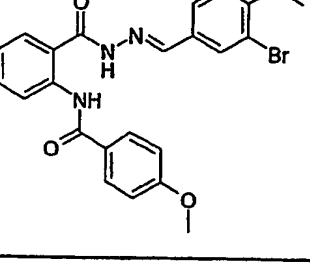
化合物71	
化合物72	
化合物73	
化合物74	
化合物75	

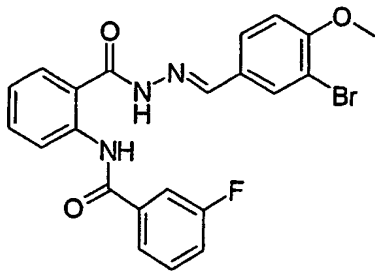
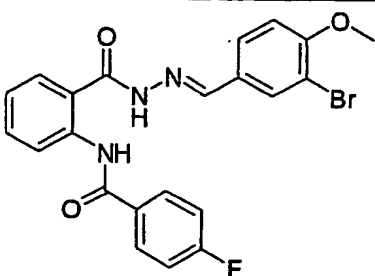
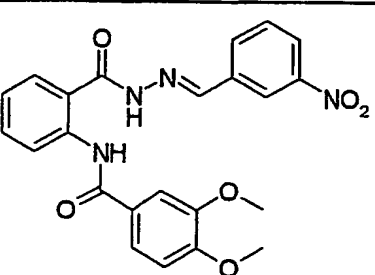
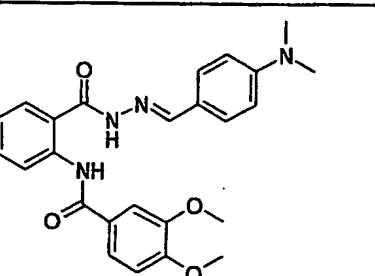
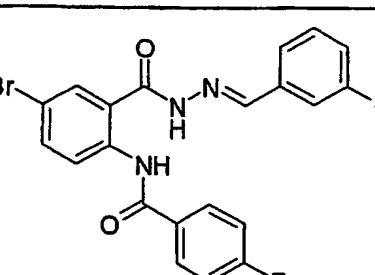
化合物76	 <chem>O=C1NC(=O)C2=CC=CC=C2N1N=Cc3ccc(F)cc3</chem>
化合物77	 <chem>O=C1NC(=O)C2=CC=CC=C2N1N=Cc3ccc(F)cc3</chem>
化合物78	 <chem>O=C1NC(=O)C2=CC=CC=C2N1N=Cc3ccc(C)cc3</chem>
化合物79	 <chem>O=C1NC(=O)C2=CC=CC=C2N1N=Cc3ccc(C)cc3</chem>
化合物80	 <chem>O=C1NC(=O)C2=CC=CC=C2N1N=Cc3ccc(O)cc3</chem>

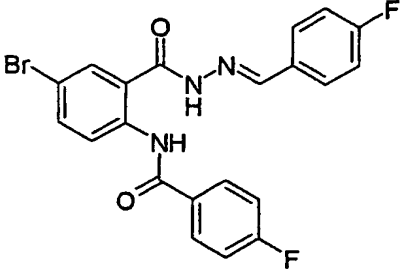
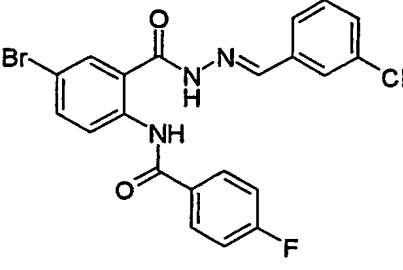
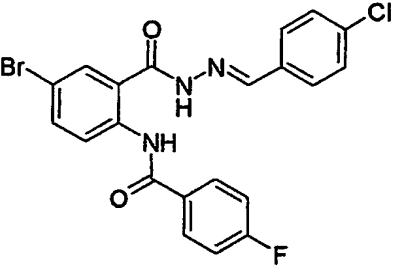
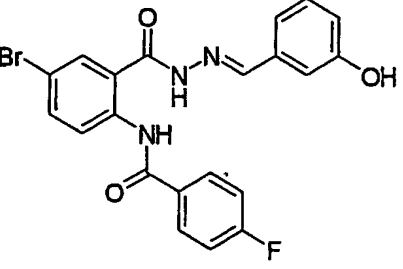
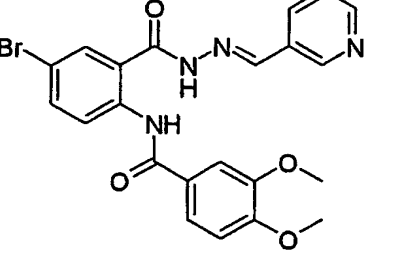
化合物81	
化合物82	
化合物83	
化合物84	
化合物85	

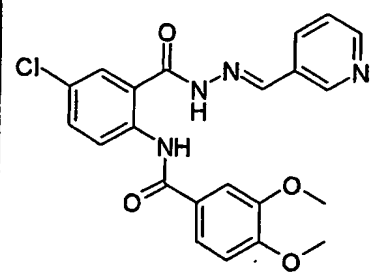
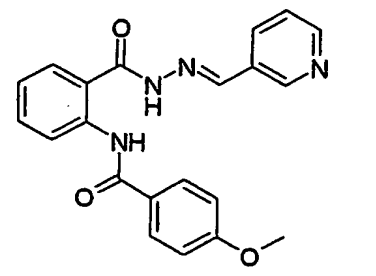
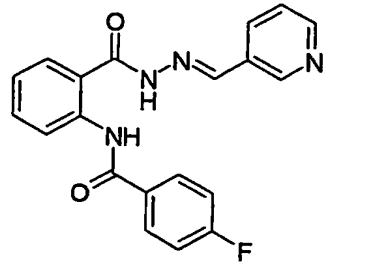
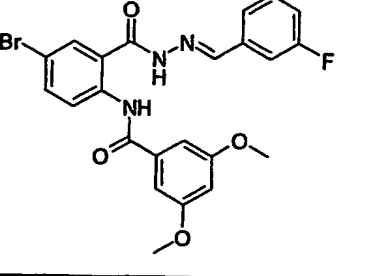
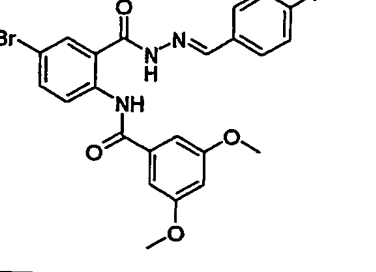
化合物86	
化合物87	
化合物88	
化合物89	
化合物90	

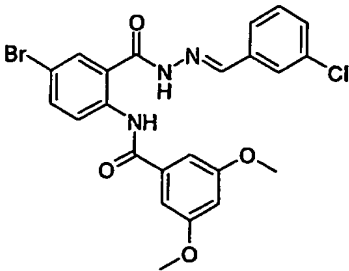
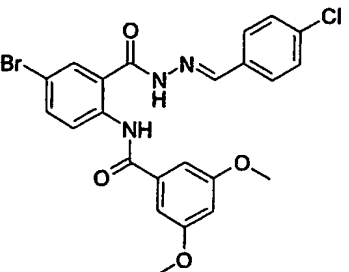
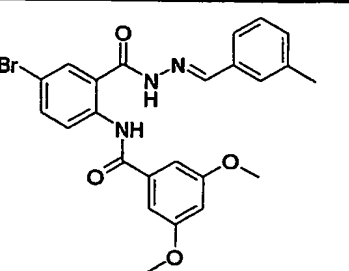
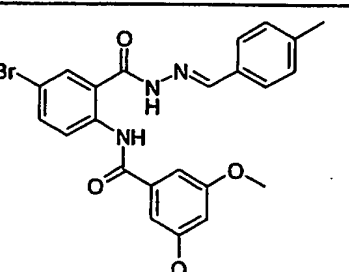
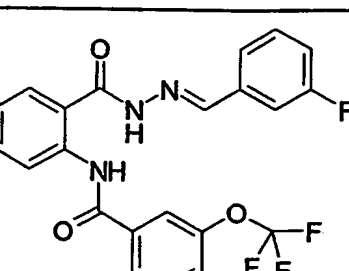
化合物91	
化合物92	
化合物93	
化合物94	
化合物95	

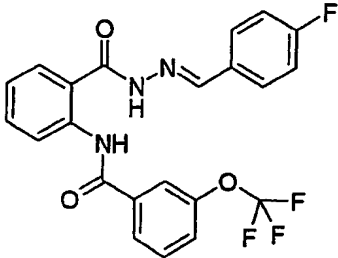
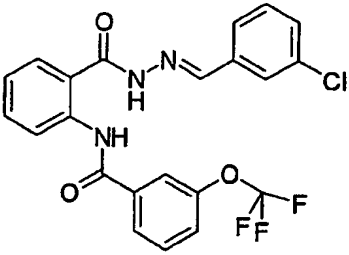
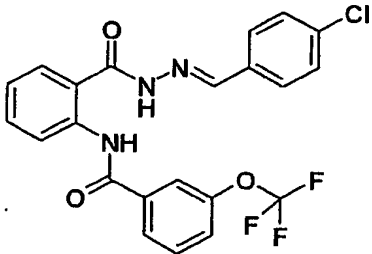
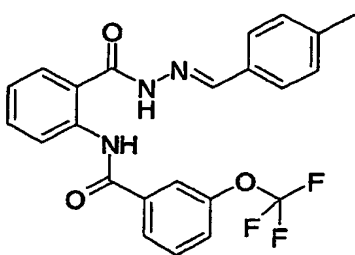
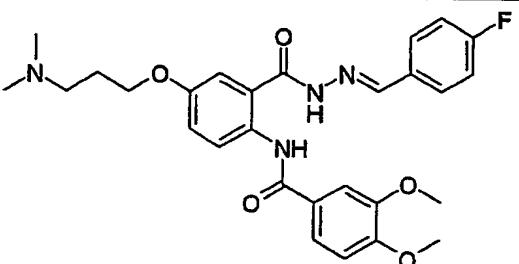
化合物96	
化合物97	
化合物98	
化合物99	
化合物100	

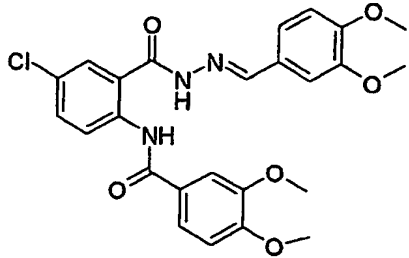
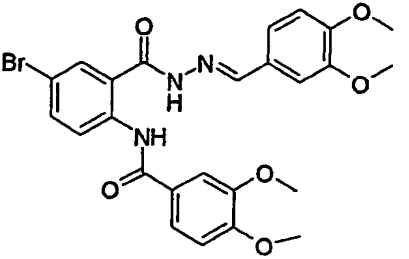
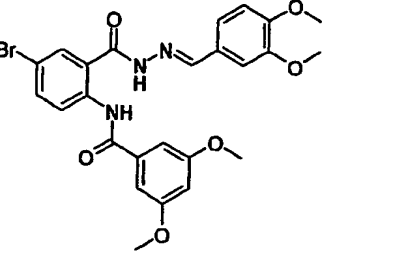
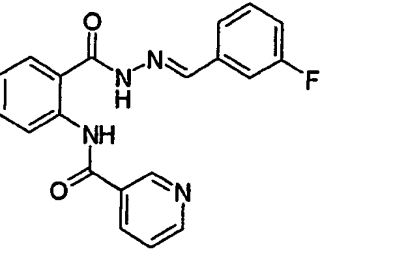
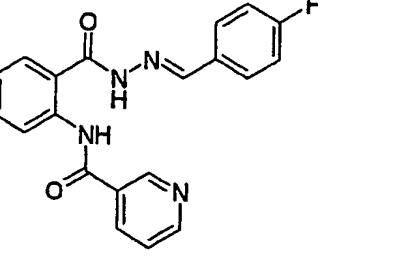
化合物101	 <chem>COc1cc(Br)ccc1C=Nc2c(=O)[nH]c3ccccc3n2C(=O)c4cccc(F)c4</chem>
化合物102	 <chem>COc1cc(Br)ccc1C=Nc2c(=O)[nH]c3ccccc3n2C(=O)c4ccc(F)cc4</chem>
化合物103	 <chem>COc1cc(OC)ccc1C(=O)Nc2c(=O)[nH]c3ccccc3n2C=Nc4ccc([N+](=O)[O-])cc4</chem>
化合物104	 <chem>CN(C)c1ccc(C=Nc2c(=O)[nH]c3ccccc3n2C(=O)c4cc(OC)cc(OC)c4)cc1</chem>
化合物105	 <chem>Fc1ccc(C=Nc2c(=O)[nH]c3cc(Br)ccc3n2C(=O)c4cc(F)ccc4Br)cc1</chem>

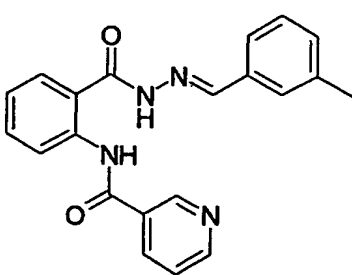
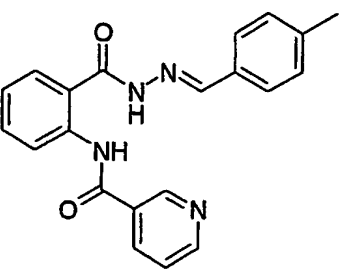
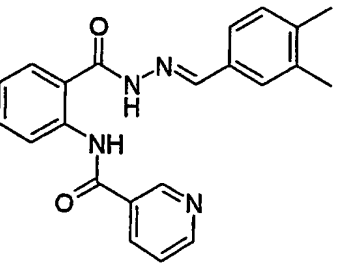
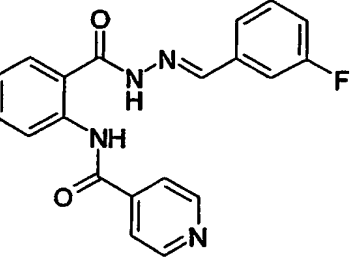
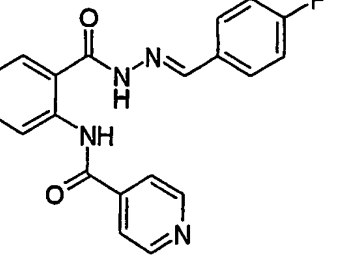
化合物106	
化合物107	
化合物108	
化合物109	
化合物110	

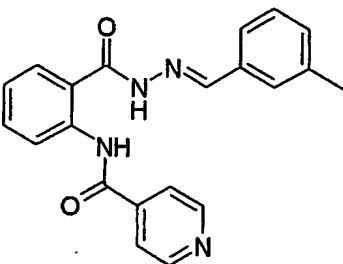
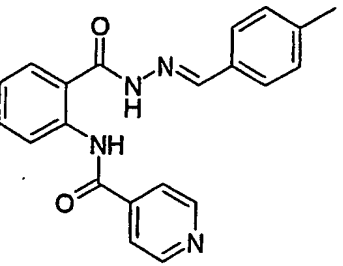
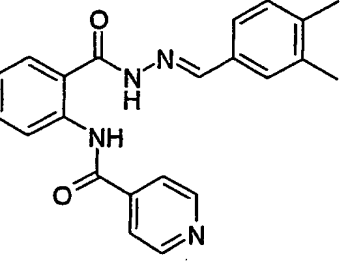
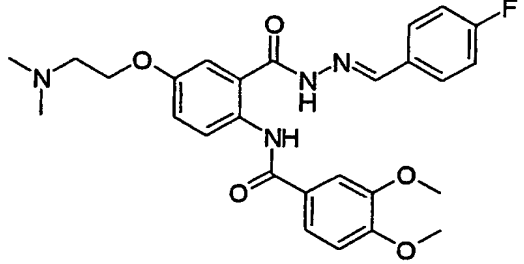
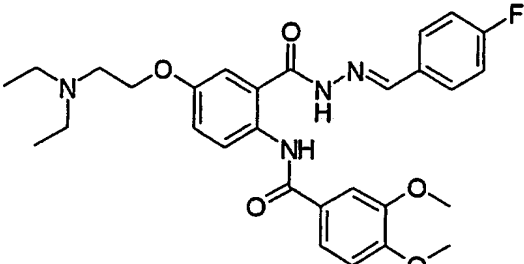
化合物111	
化合物112	
化合物113	
化合物114	
化合物115	

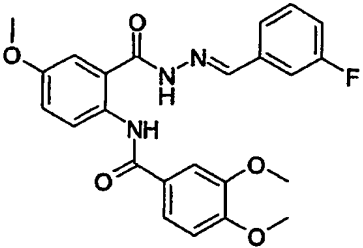
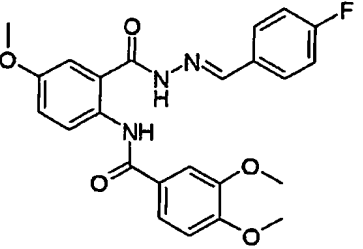
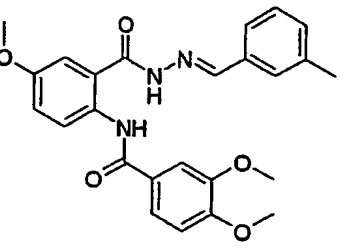
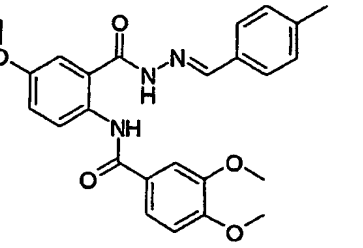
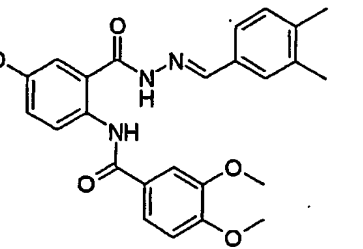
化合物116	
化合物117	
化合物118	
化合物119	
化合物120	

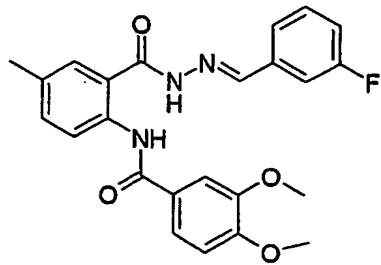
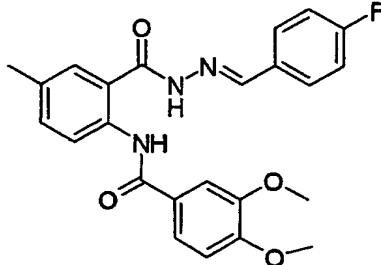
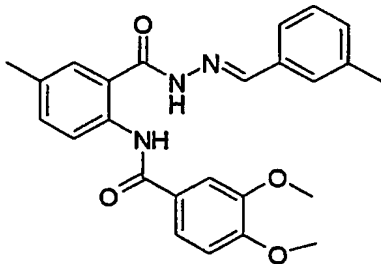
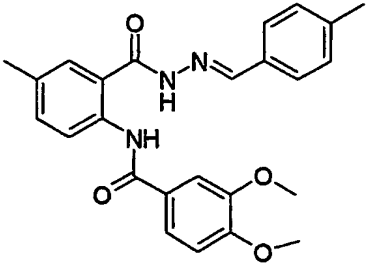
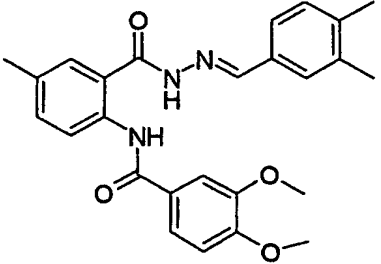
化合物121	
化合物122	
化合物123	
化合物124	
化合物125	

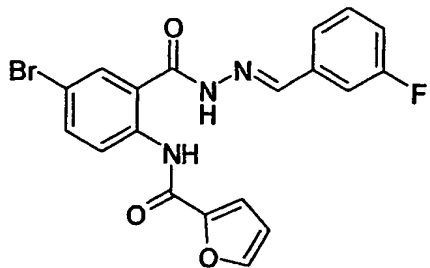
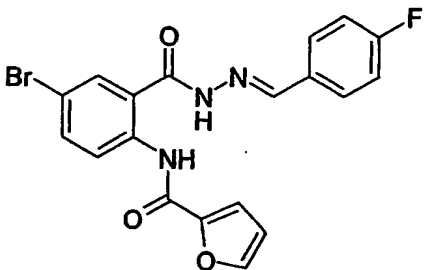
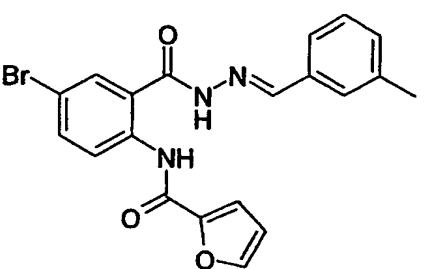
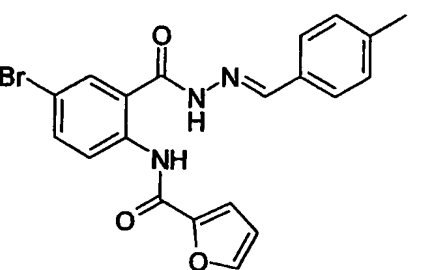
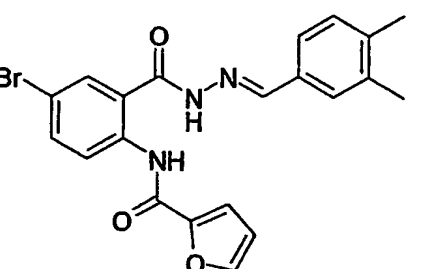
化合物126	
化合物127	
化合物128	
化合物129	
化合物130	

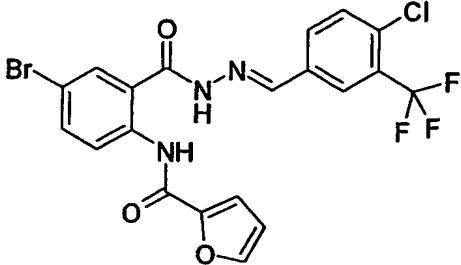
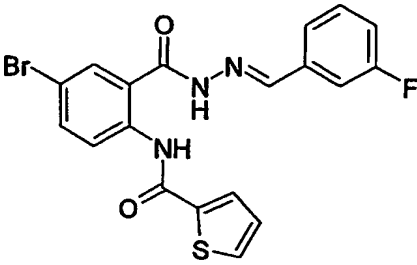
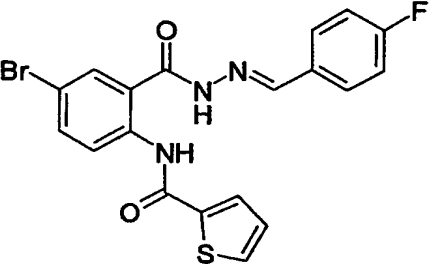
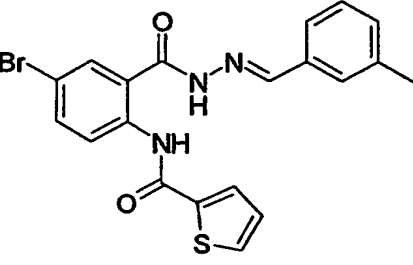
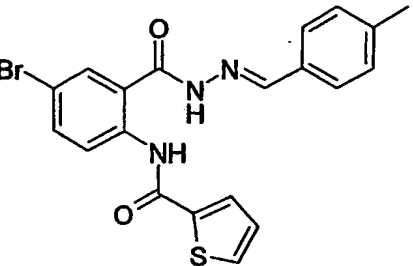
化合物131	 <chem>Cc1ccc(cc1)/C=N/Nc2c(cnc2C(=O)c3ccncc3)C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物132	 <chem>Cc1ccc(cc1)/C=N/Nc2c(cnc2C(=O)c3ccncc3)C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物133	 <chem>Cc1ccc(cc1)/C=N/Nc2c(cnc2C(=O)c3ccncc3)C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物134	 <chem>Fc1ccc(cc1)/C=N/Nc2c(cnc2C(=O)c3ccncc3)C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物135	 <chem>Fc1ccc(cc1)/C=N/Nc2c(cnc2C(=O)c3ccncc3)C(=O)c4ccncc4</chem>

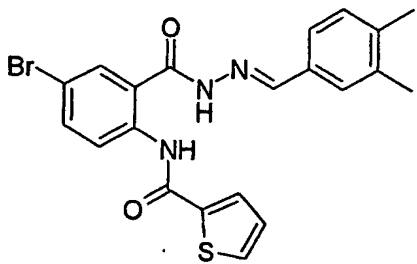
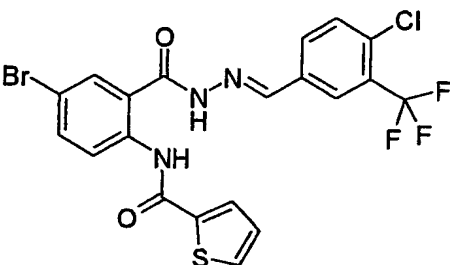
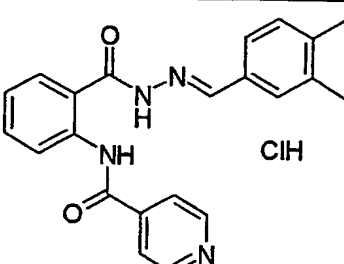
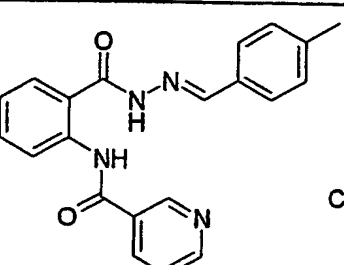
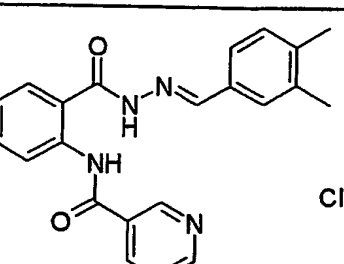
化合物136	
化合物137	
化合物138	
化合物139	
化合物140	

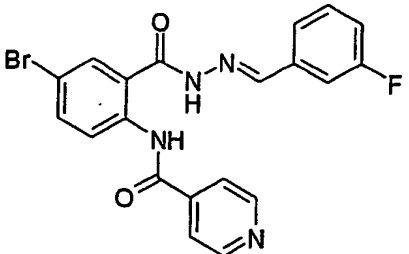
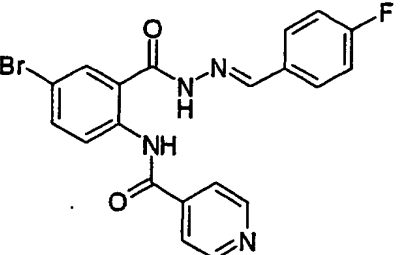
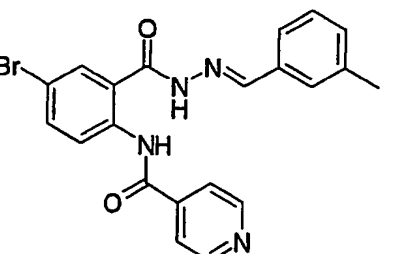
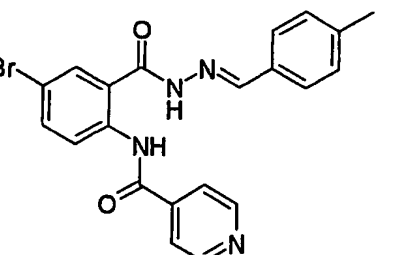
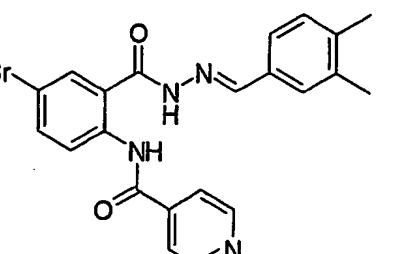
化合物141	
化合物142	
化合物143	
化合物144	
化合物145	

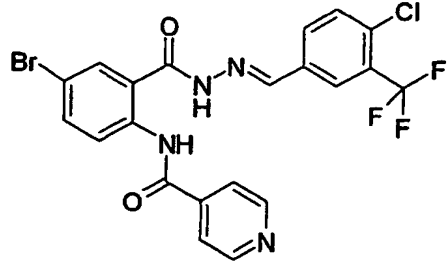
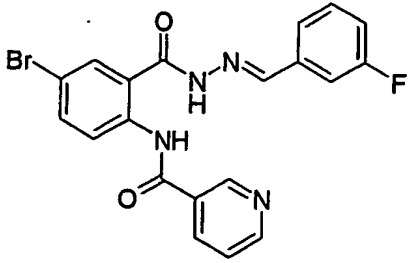
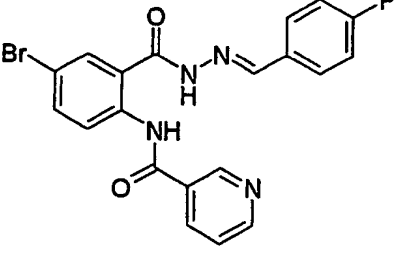
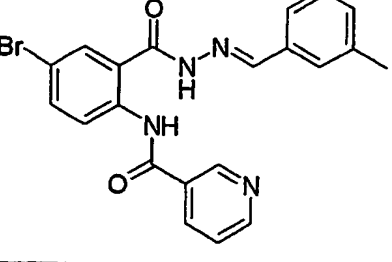
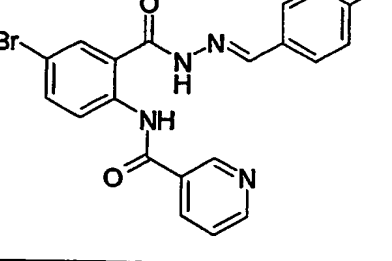
化合物146	
化合物147	
化合物148	
化合物149	
化合物150	

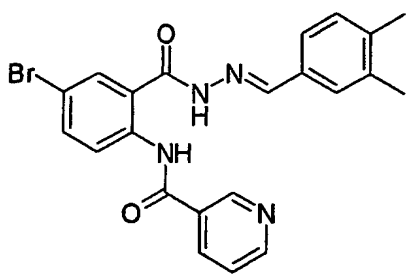
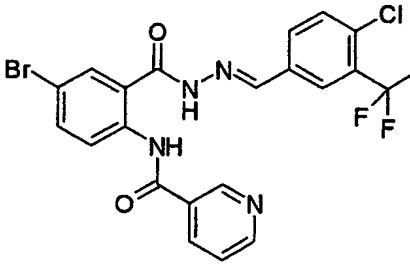
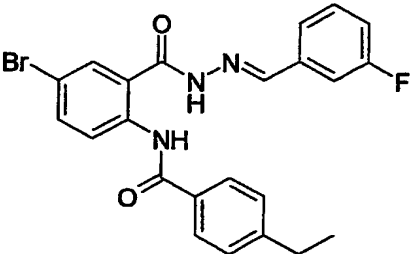
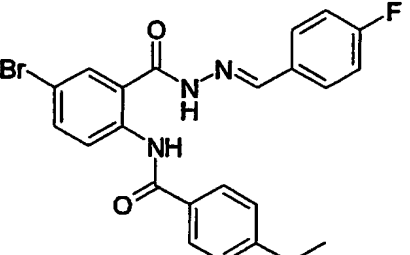
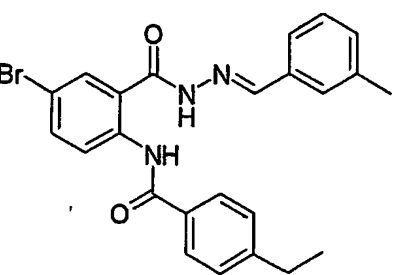
化合物151	
化合物152	
化合物153	
化合物154	
化合物155	

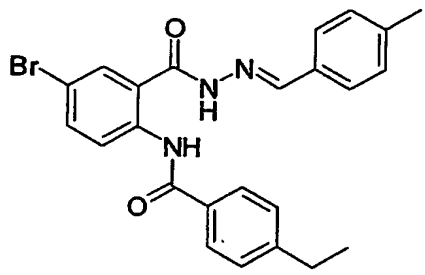
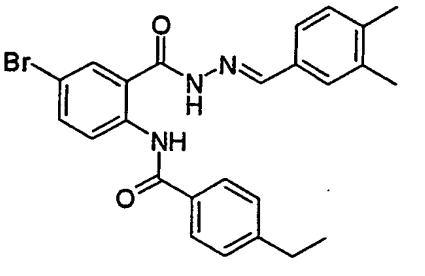
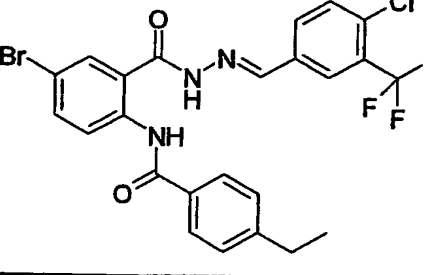
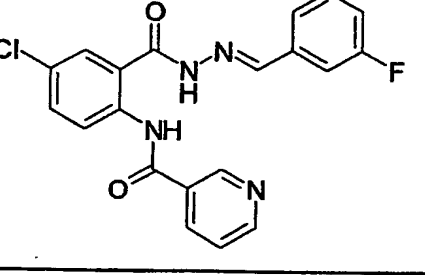
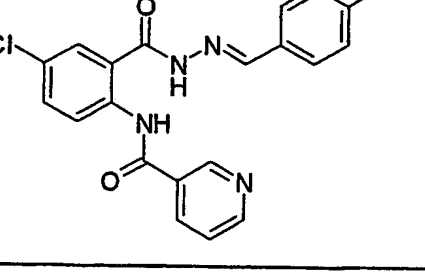
化合物156	
化合物157	
化合物158	
化合物159	
化合物160	

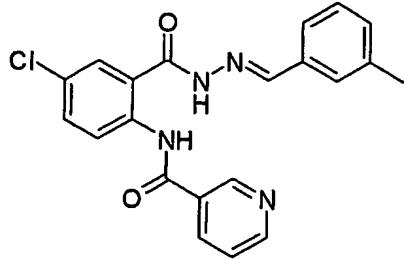
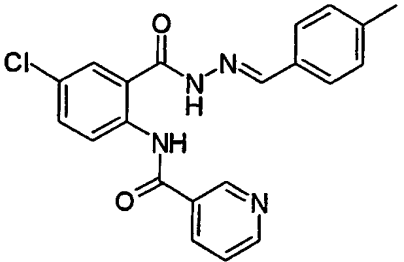
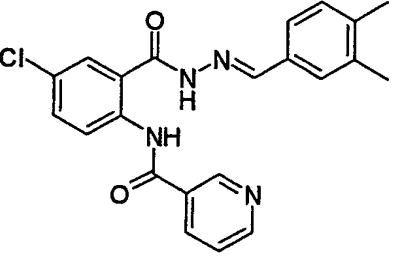
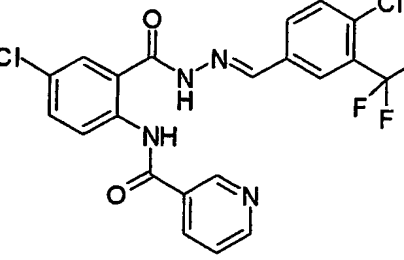
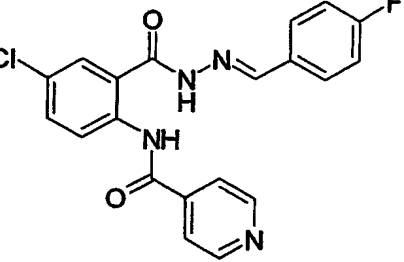
化合物161	
化合物162	
化合物163	
化合物164	
化合物165	

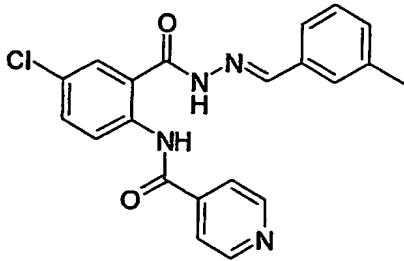
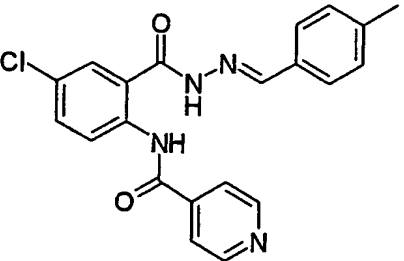
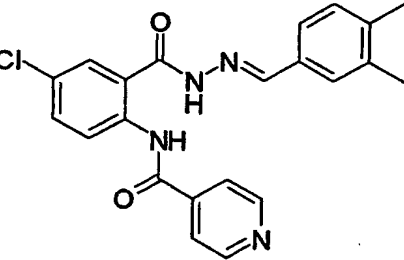
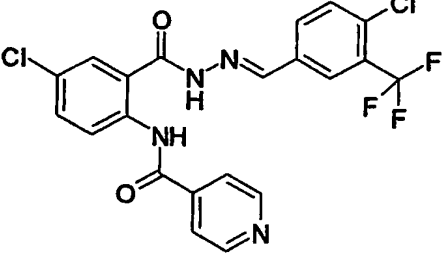
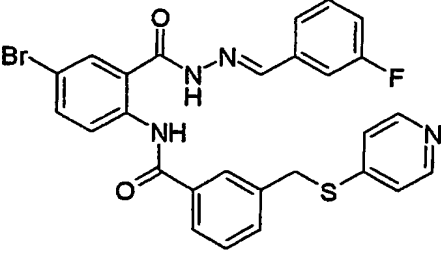
化合物166	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(=O)[nH]c2c(=O)Nc3ccc(F)cc3C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物167	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(=O)[nH]c2c(=O)Nc3ccc(F)cc3C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物168	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(=O)[nH]c2c(=O)Nc3ccc(C)cc3C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物169	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(=O)[nH]c2c(=O)Nc3ccc(C)cc3C(=O)c4ccncc4</chem>
化合物170	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(=O)[nH]c2c(=O)Nc3ccc(C)cc3C(=O)c4ccncc4</chem>

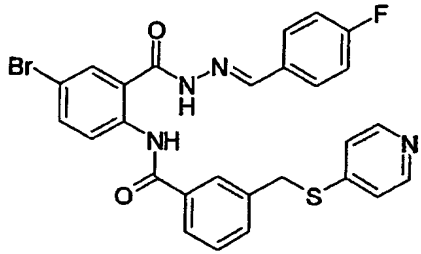
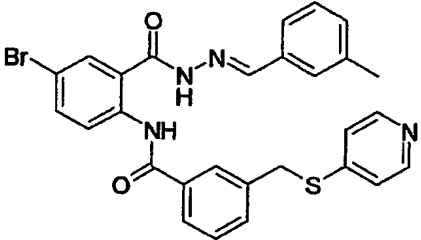
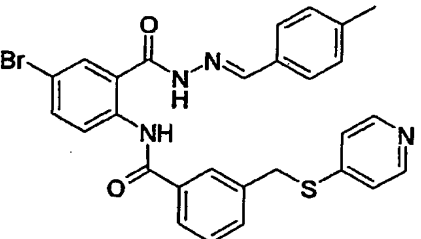
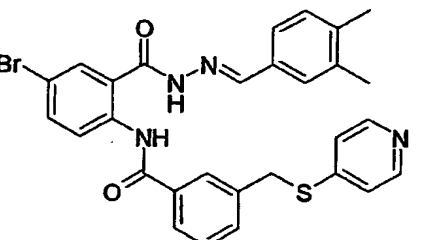
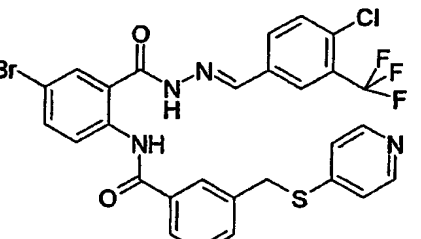
化合物171	
化合物172	
化合物173	
化合物174	
化合物175	

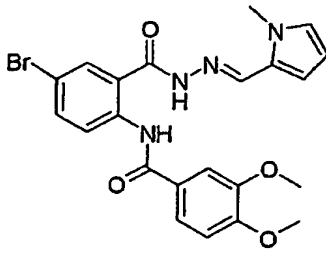
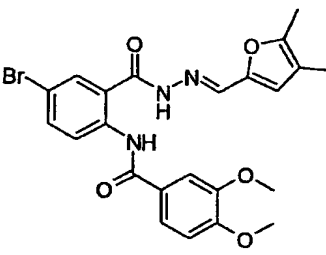
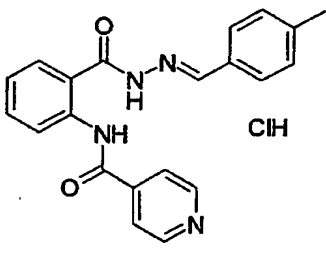
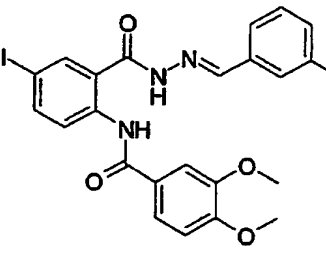
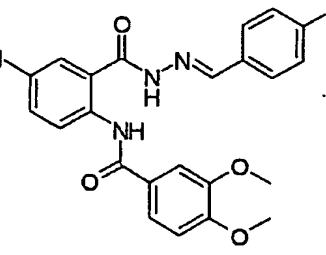
化合物176	
化合物177	
化合物178	
化合物179	
化合物180	

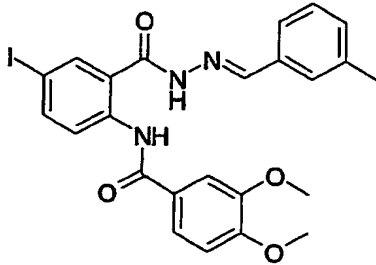
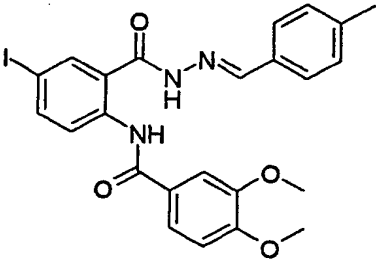
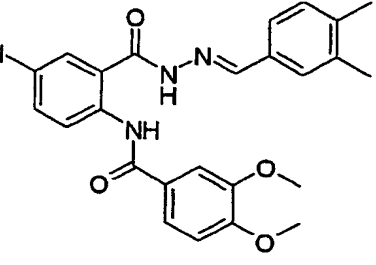
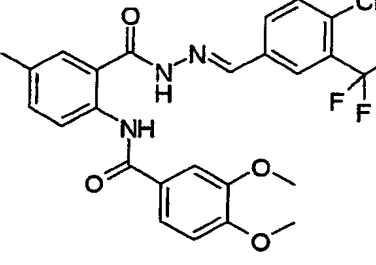
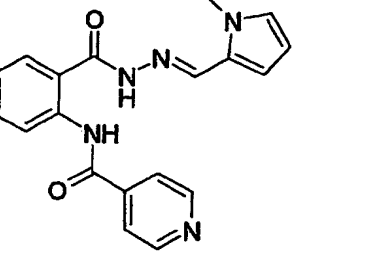
化合物181	
化合物182	
化合物183	
化合物184	
化合物185	

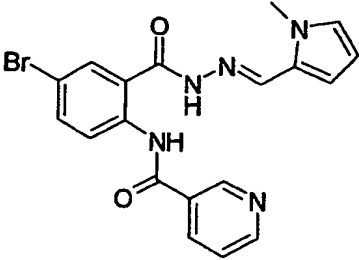
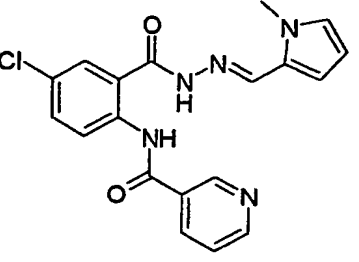
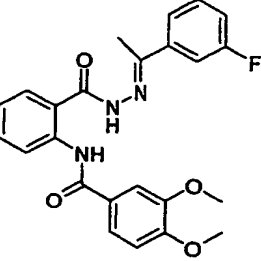
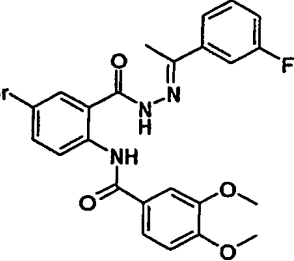
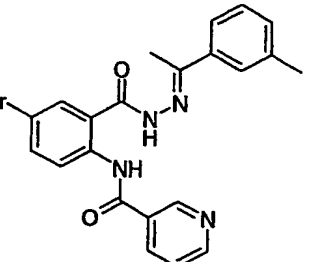
化合物186	
化合物187	
化合物188	
化合物189	
化合物190	

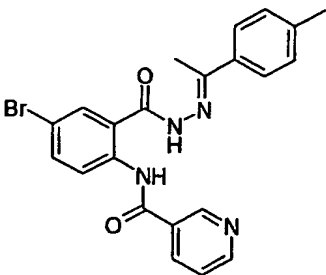
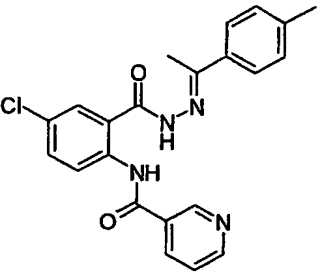
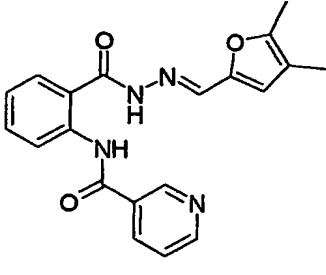
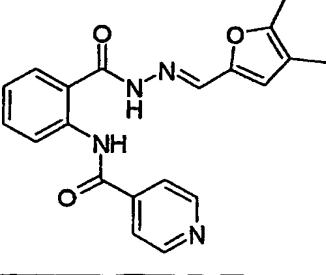
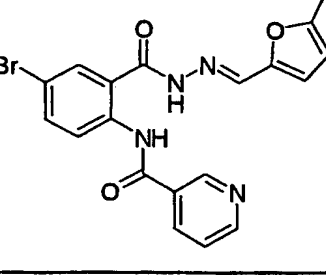
化合物191	
化合物192	
化合物193	
化合物194	
化合物195	

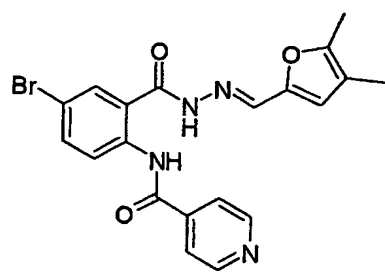
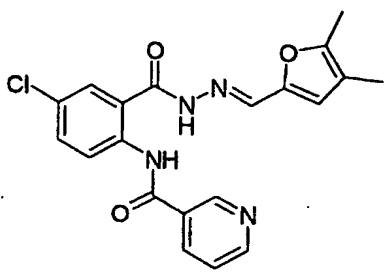
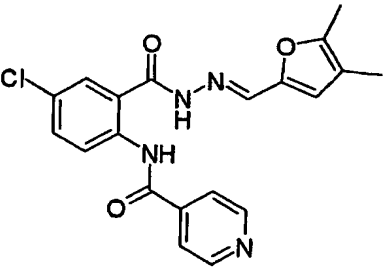
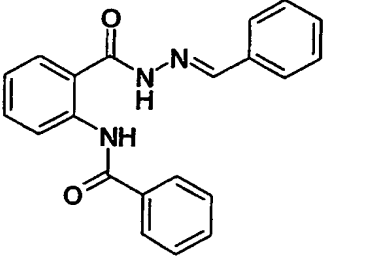
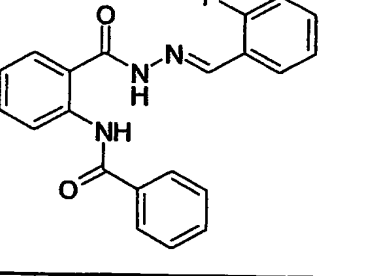
化合物196	
化合物197	
化合物198	
化合物199	
化合物200	

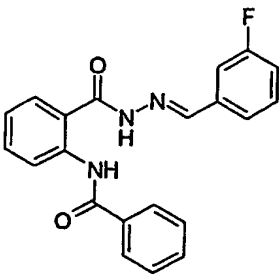
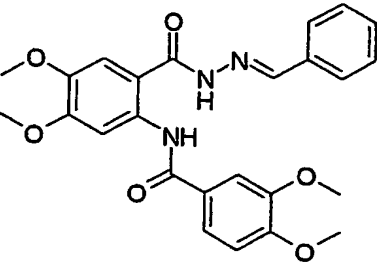
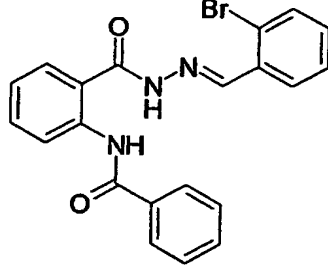
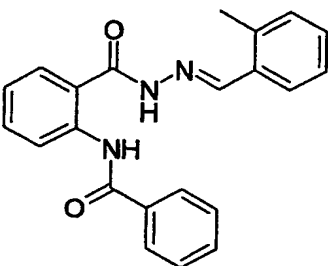
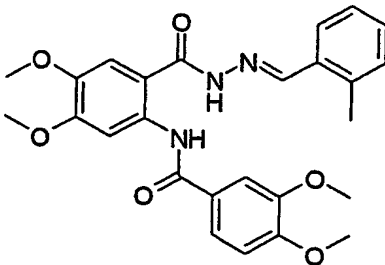
化合物201	
化合物202	
化合物203	
化合物204	
化合物205	

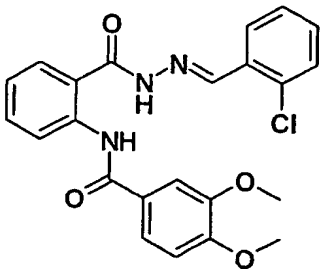
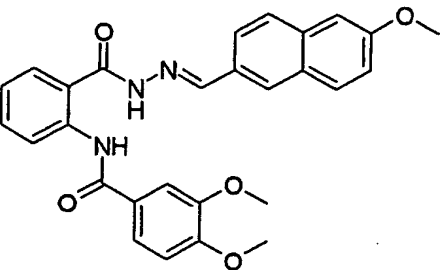
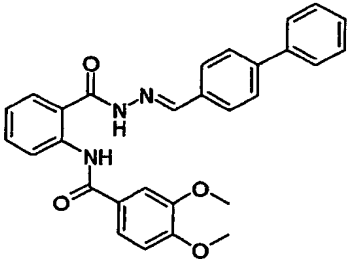
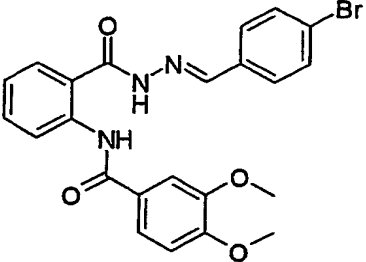
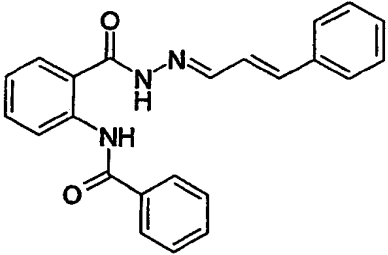
化合物206	
化合物207	
化合物208	
化合物209	
化合物210	

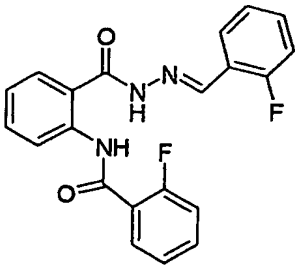
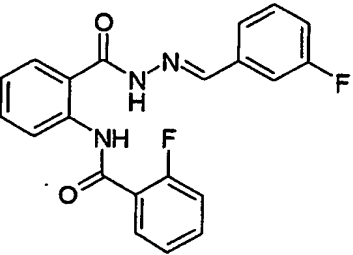
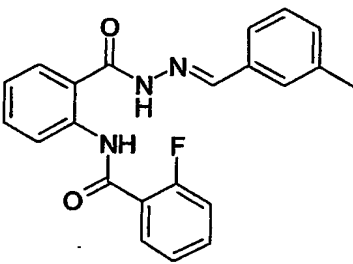
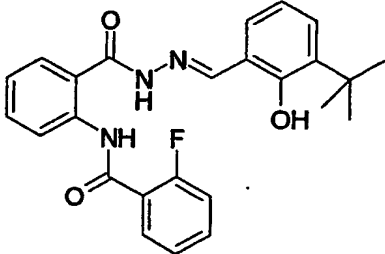
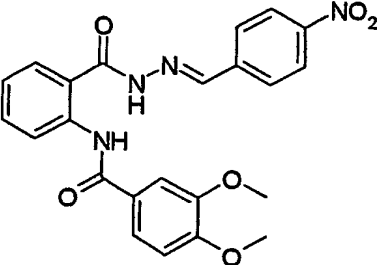
化合物211	
化合物212	
化合物213	
化合物214	
化合物215	

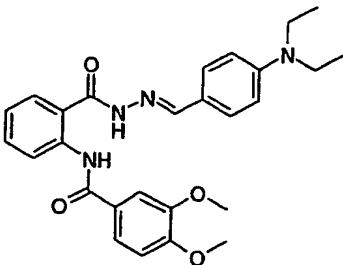
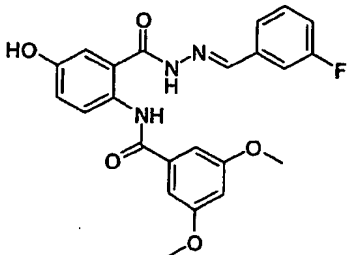
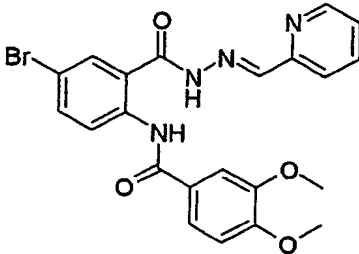
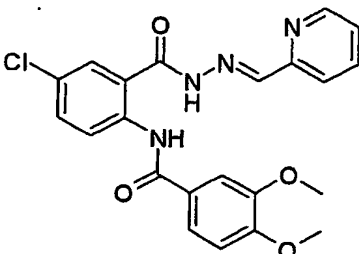
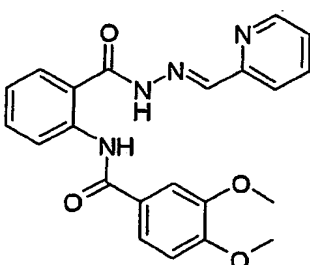
化合物216	
化合物217	
化合物218	
化合物219	
化合物220	

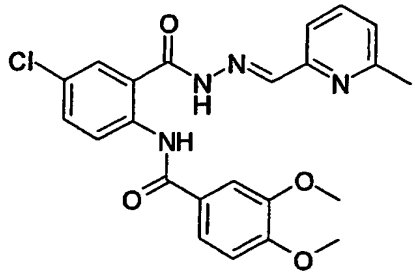
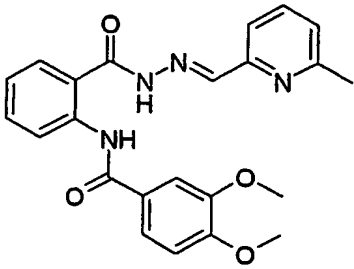
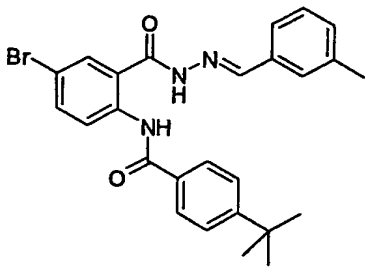
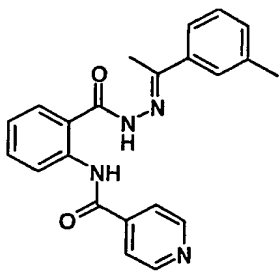
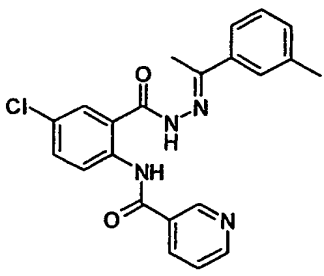
化合物221	
化合物222	
化合物223	
化合物224	
化合物225	

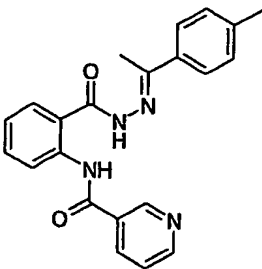
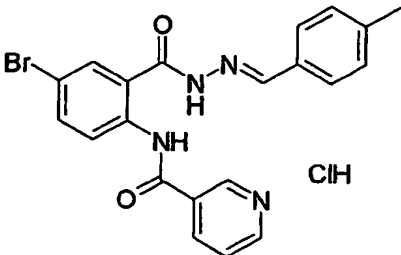
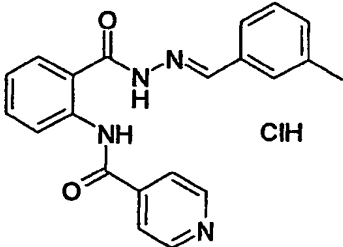
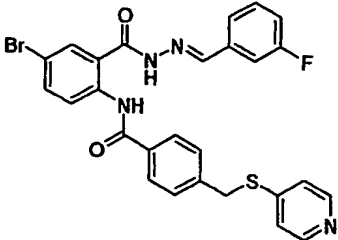
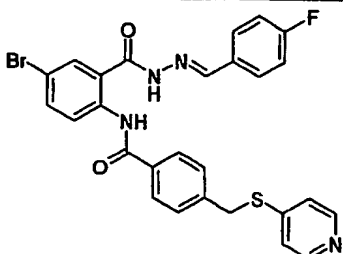
化合物226	
化合物227	
化合物228	
化合物229	
化合物230	

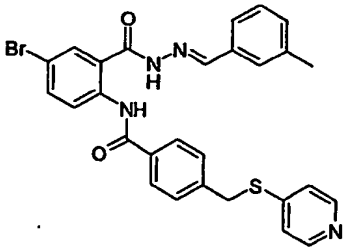
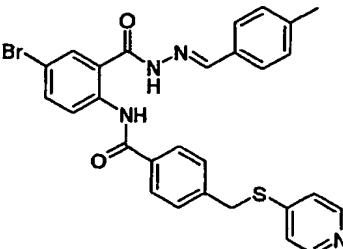
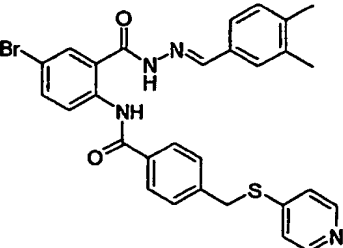
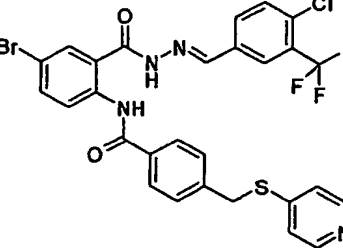
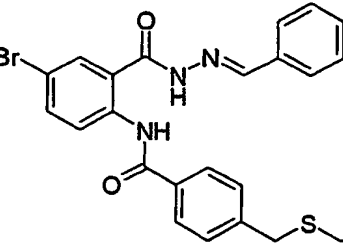
化合物231	
化合物232	
化合物233	
化合物234	
化合物235	

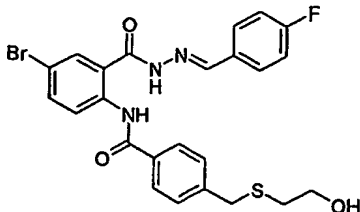
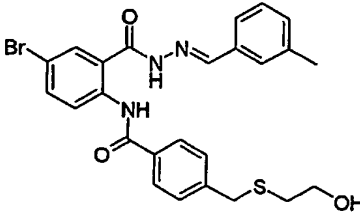
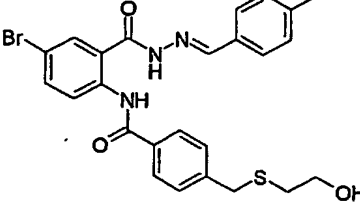
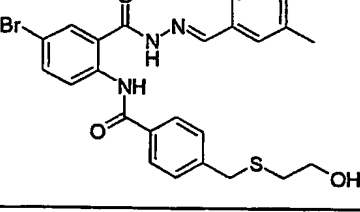
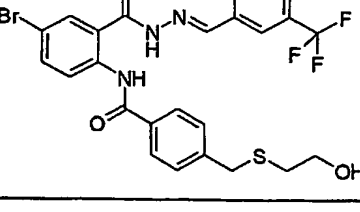
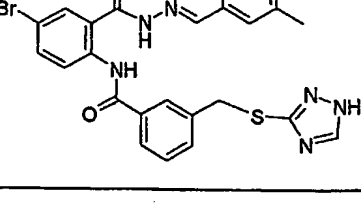
化合物236	
化合物237	
化合物238	
化合物239	
化合物240	

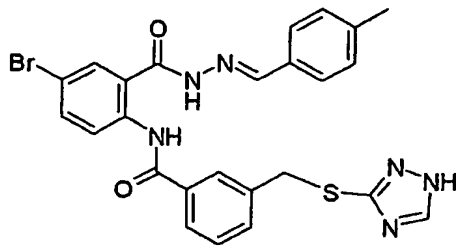
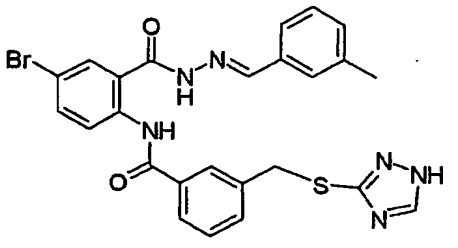
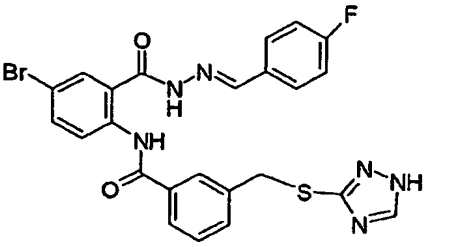
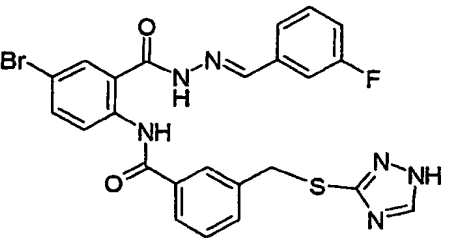
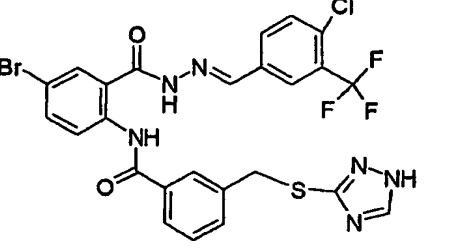
化合物241	
化合物242	
化合物243	
化合物244	
化合物245	

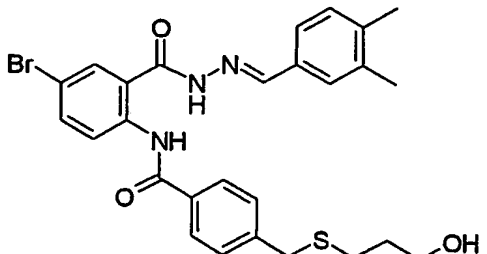
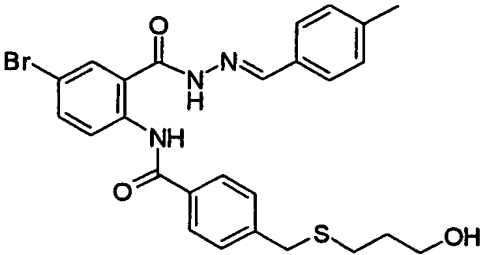
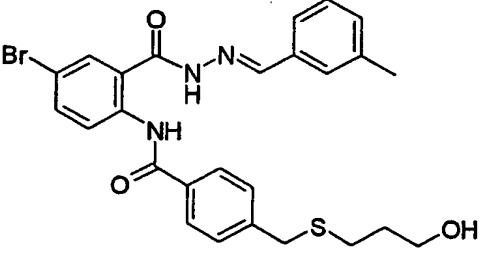
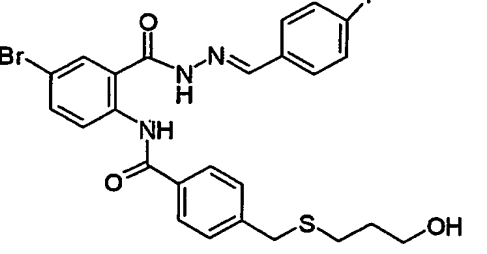
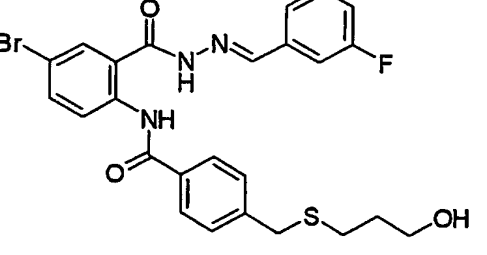
化合物246	
化合物247	
化合物248	
化合物249	
化合物250	

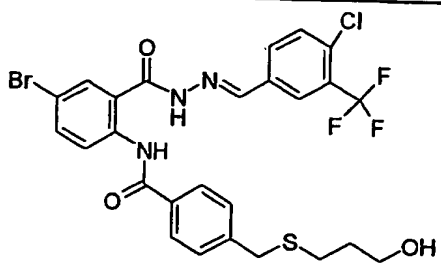
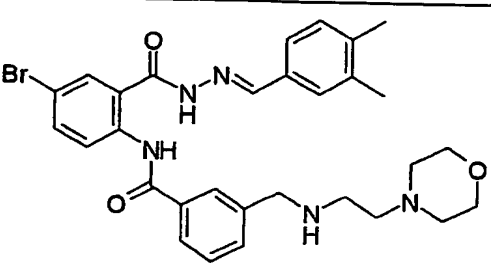
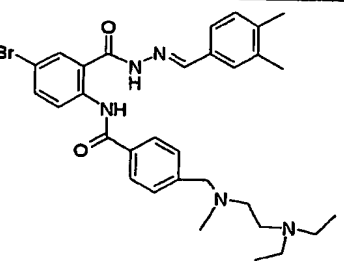
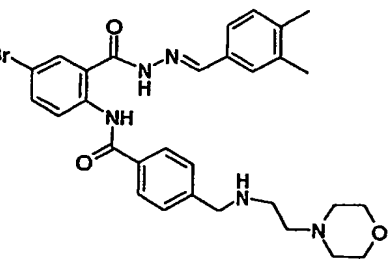
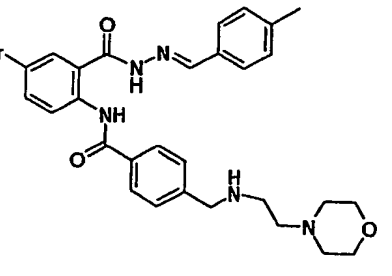
化合物251	
化合物252	
化合物253	
化合物255	
化合物256	

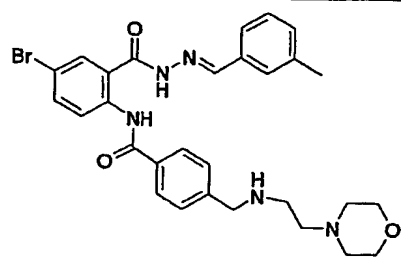
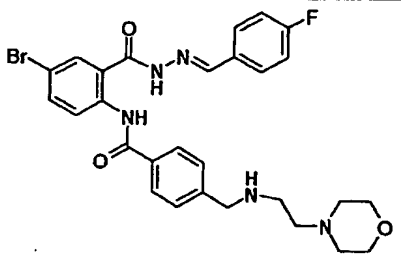
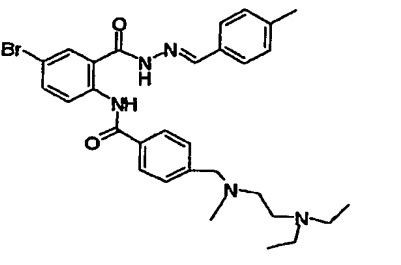
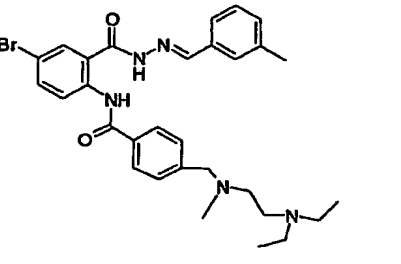
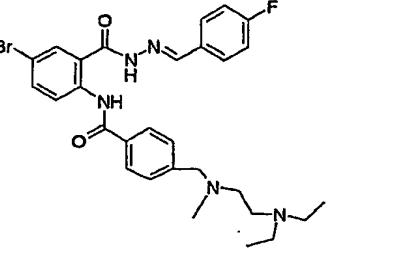
化合物257	
化合物258	
化合物259	
化合物260	
化合物261	

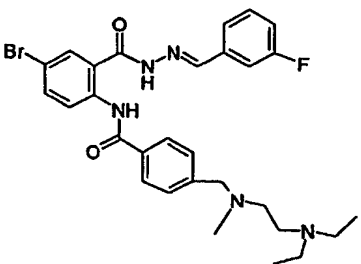
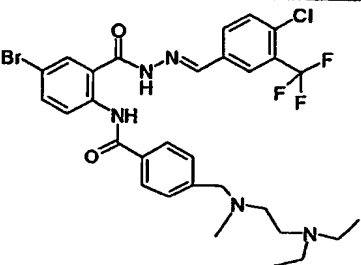
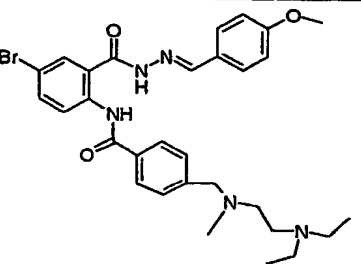
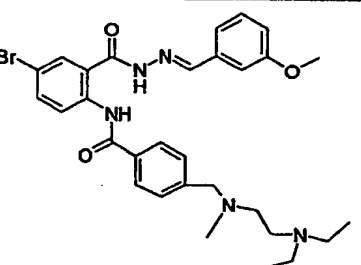
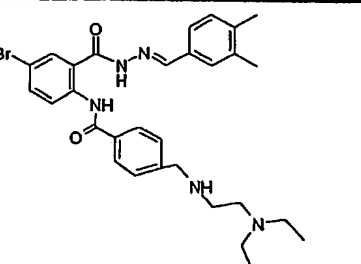
化合物262	
化合物263	
化合物264	
化合物265	
化合物266	
化合物267	

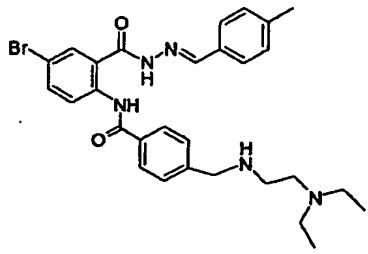
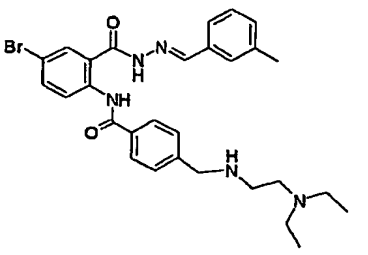
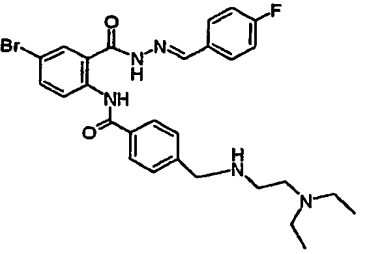
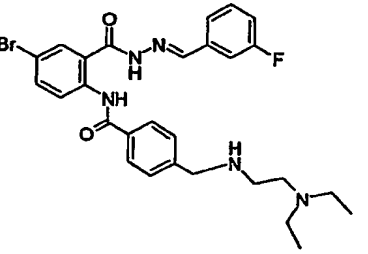
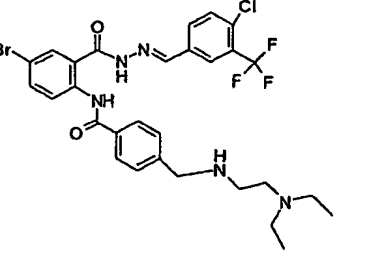
化合物268	
化合物269	
化合物270	
化合物271	
化合物272	

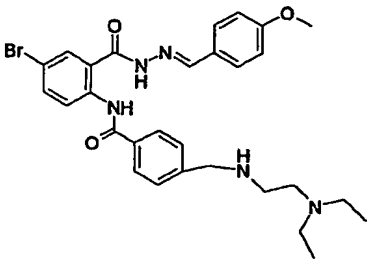
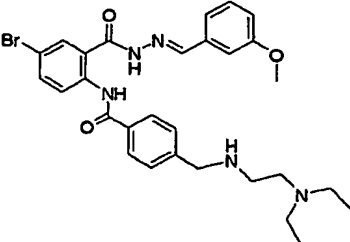
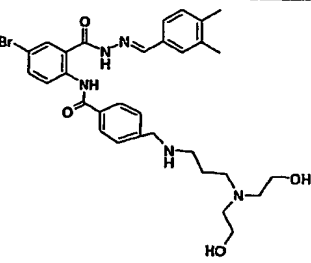
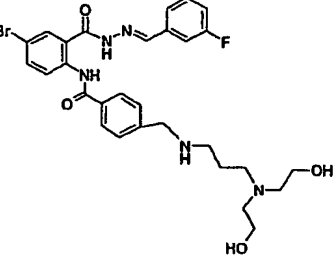
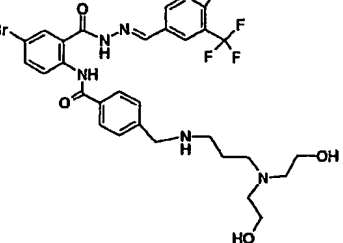
化合物273	
化合物274	
化合物275	
化合物276	
化合物277	

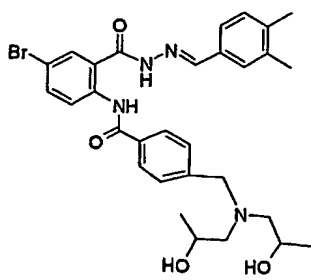
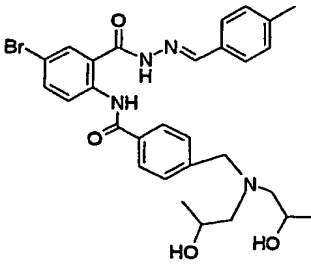
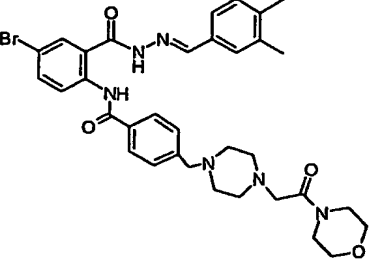
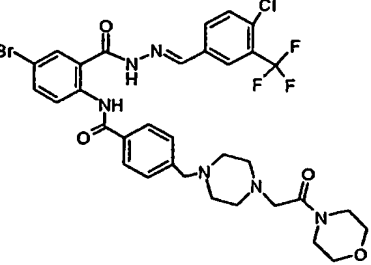
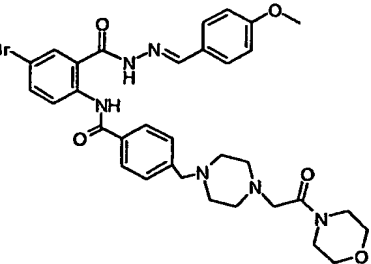
化合物278	
化合物279	
化合物280	
化合物281	
化合物282	

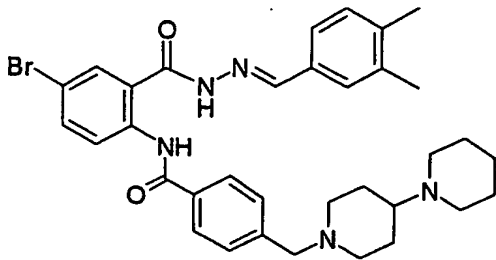
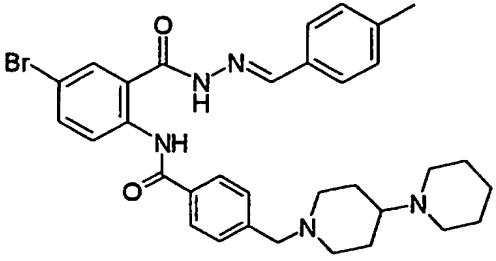
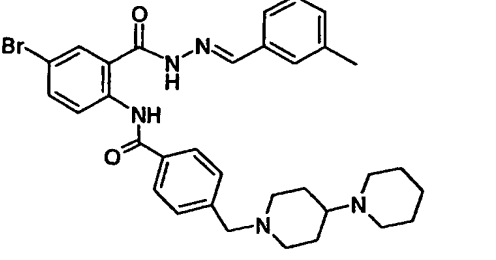
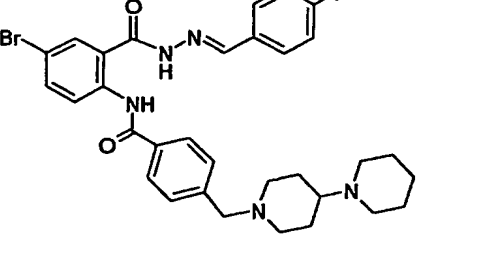
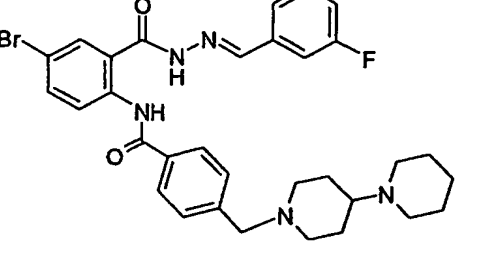
化合物283	
化合物284	
化合物285	
化合物286	
化合物287	

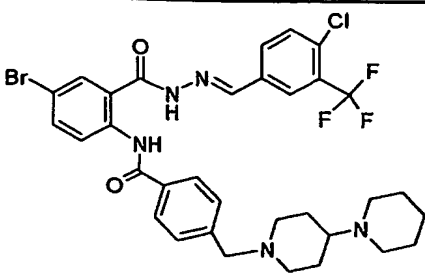
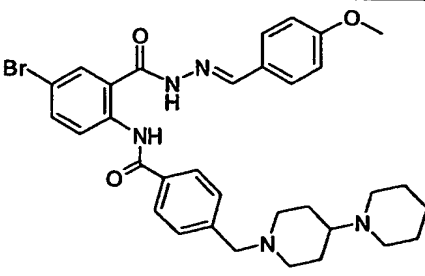
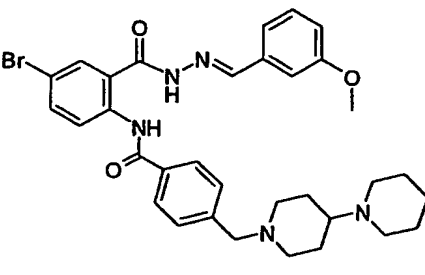
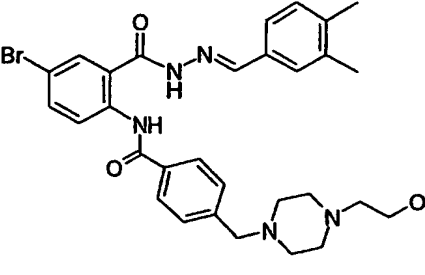
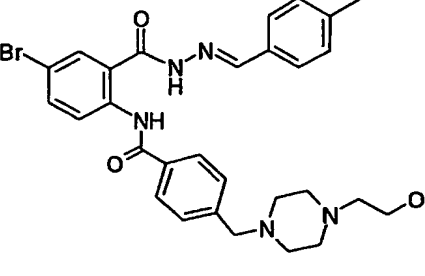
化合物288	
化合物289	
化合物290	
化合物291	
化合物292	

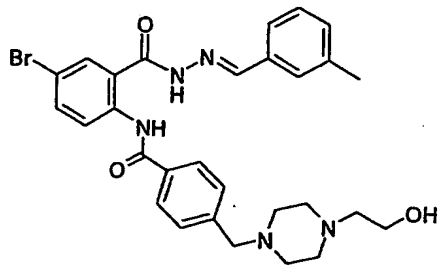
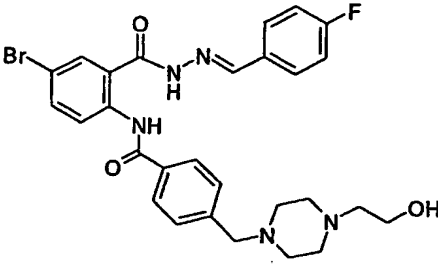
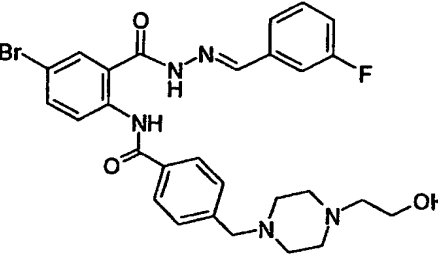
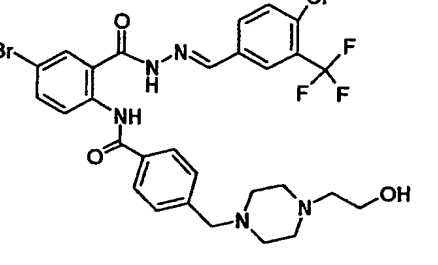
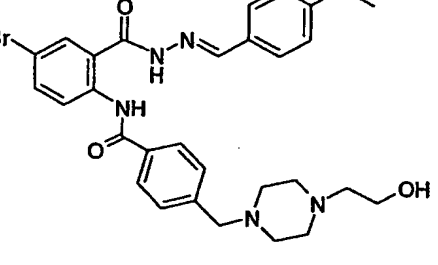
化合物293	
化合物294	
化合物295	
化合物296	
化合物297	

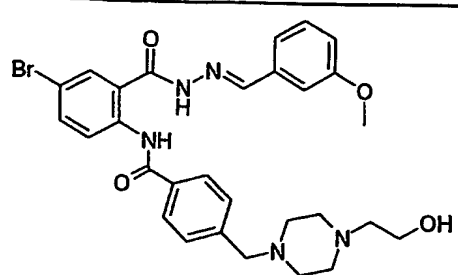
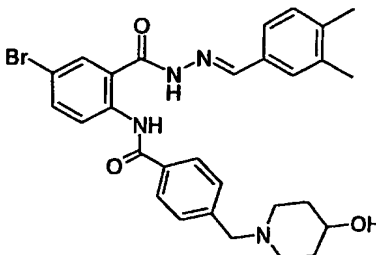
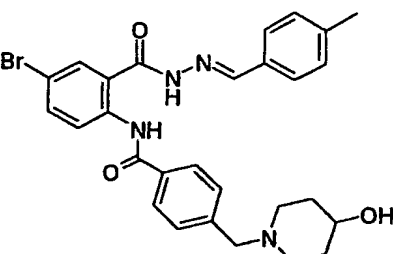
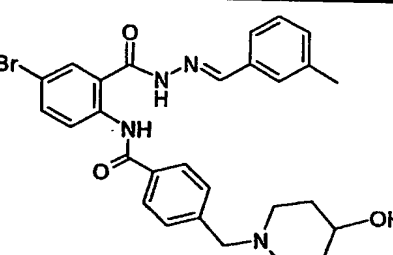
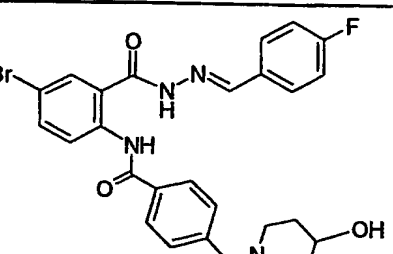
化合物298	
化合物299	
化合物300	
化合物301	
化合物302	

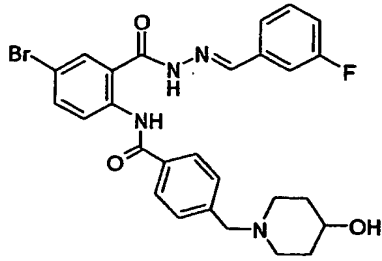
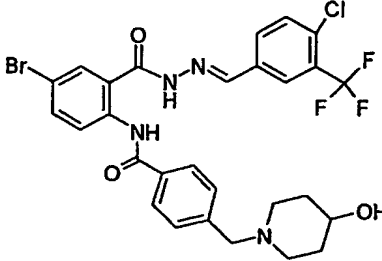
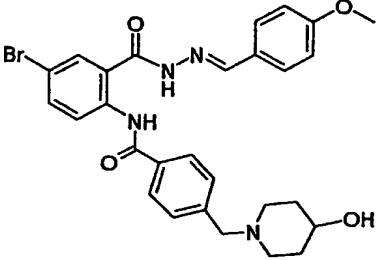
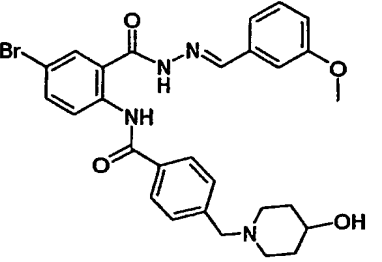
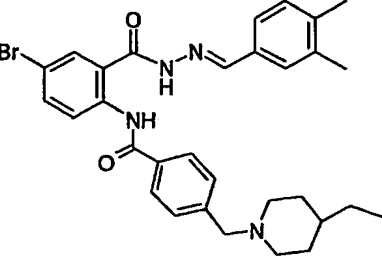
化合物303	
化合物304	
化合物305	
化合物306	
化合物307	

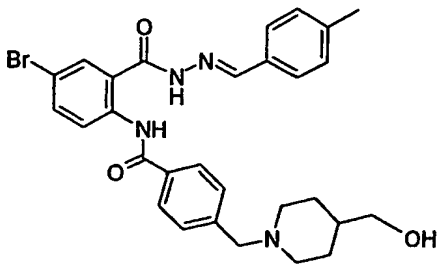
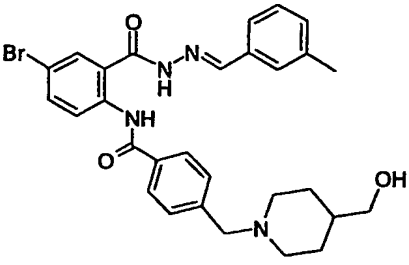
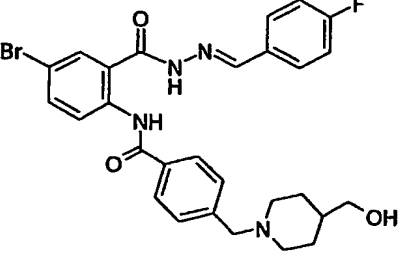
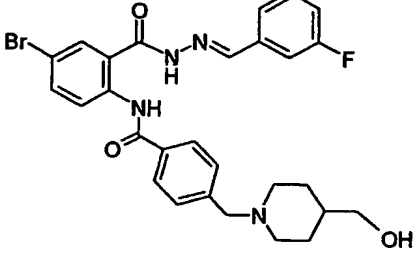
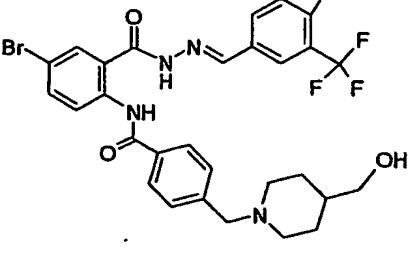
化合物308	
化合物309	
化合物310	
化合物311	
化合物312	

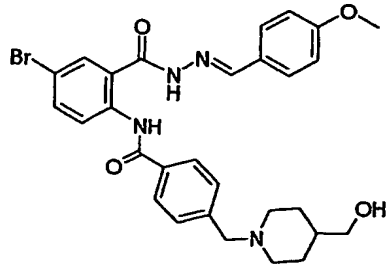
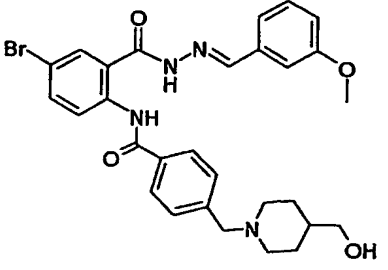
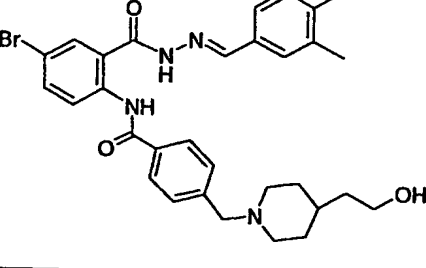
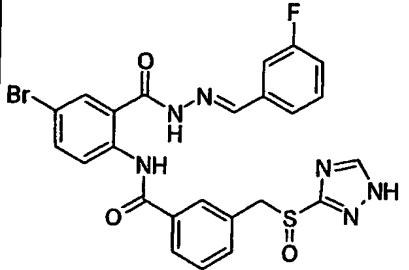
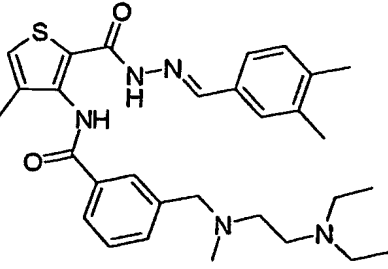
化合物313	
化合物314	
化合物315	
化合物316	
化合物317	

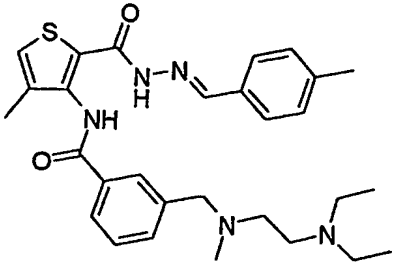
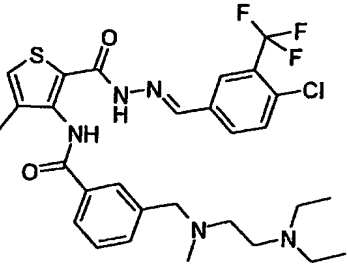
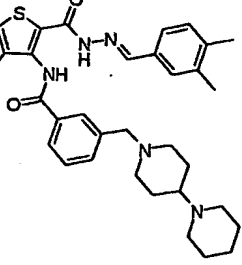
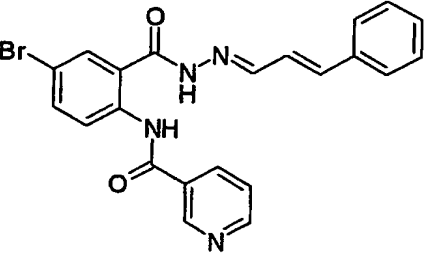
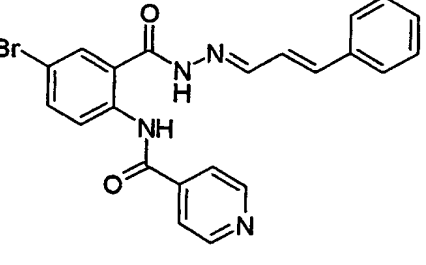
化合物318	
化合物319	
化合物320	
化合物321	
化合物322	

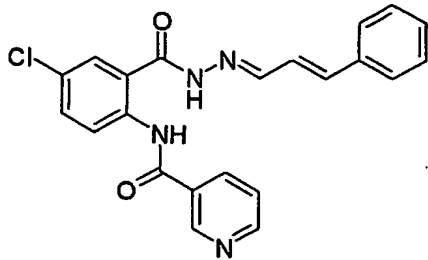
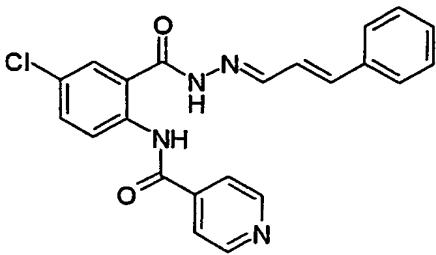
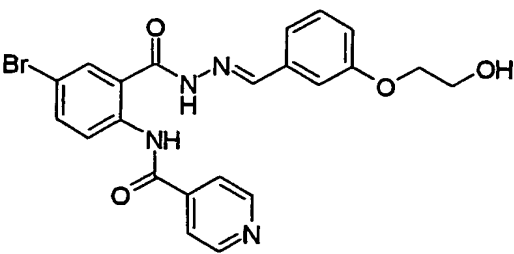
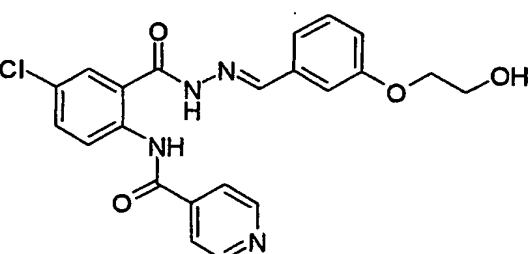
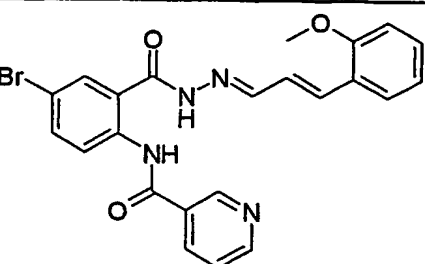
化合物323	
化合物324	
化合物325	
化合物326	
化合物327	

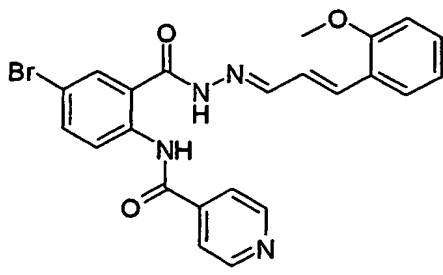
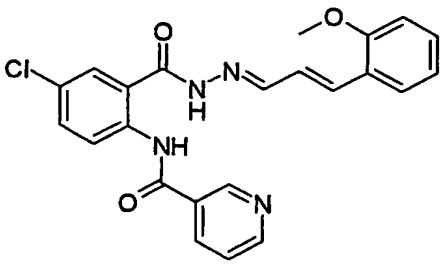
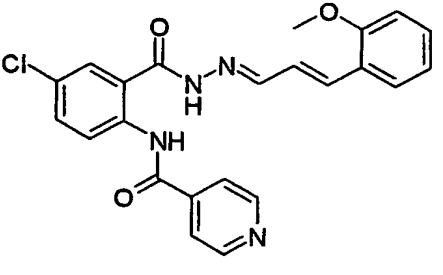
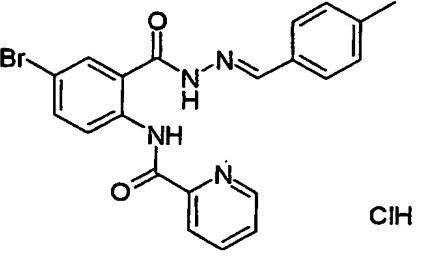
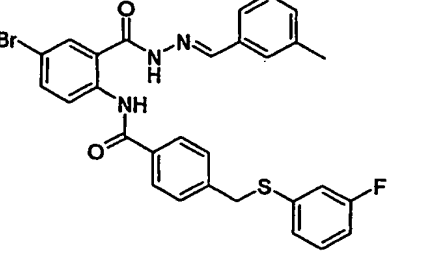
化合物328	
化合物329	
化合物330	
化合物331	
化合物332	

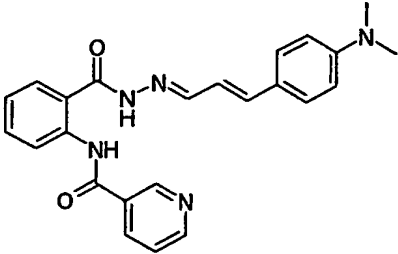
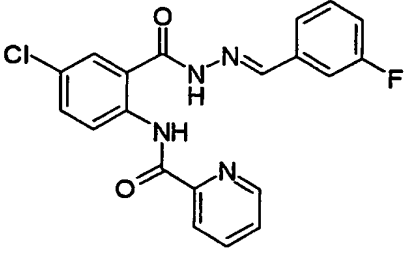
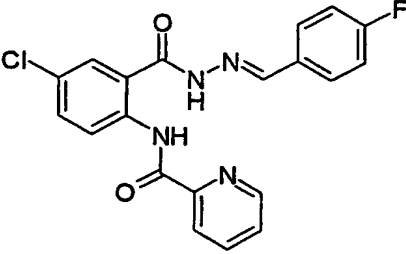
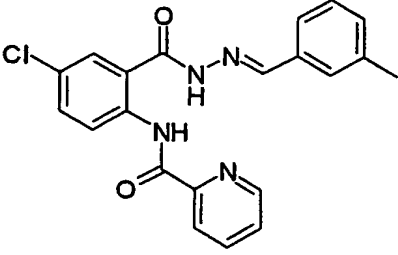
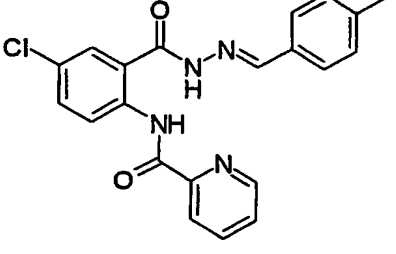
化合物333	
化合物334	
化合物335	
化合物336	
化合物337	

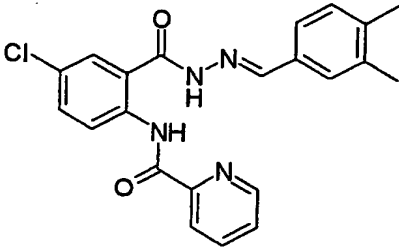
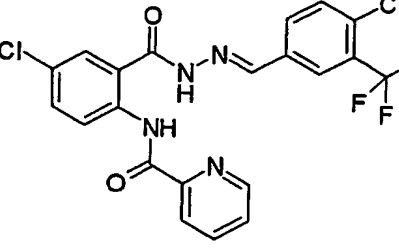
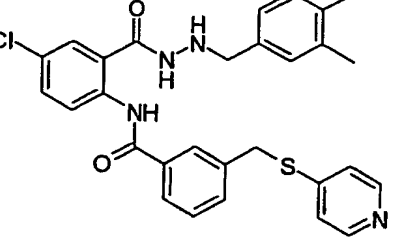
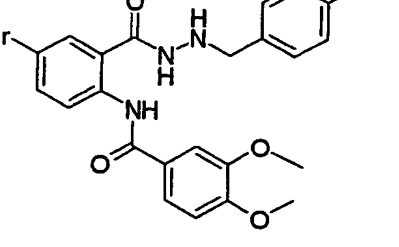
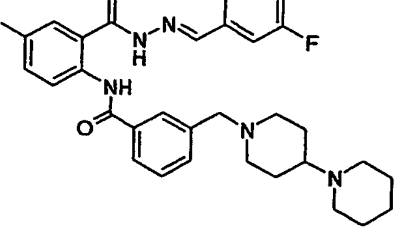
化合物338	
化合物339	
化合物340	
化合物341	
化合物342	

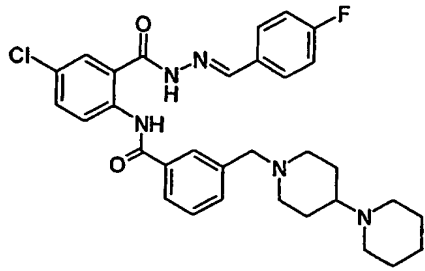
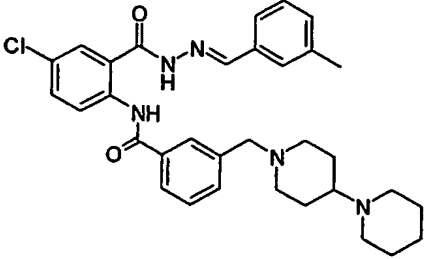
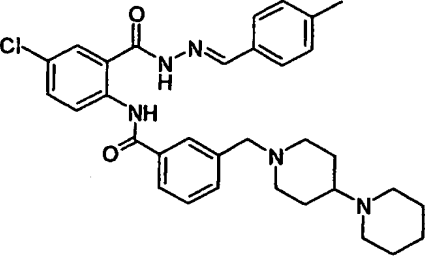
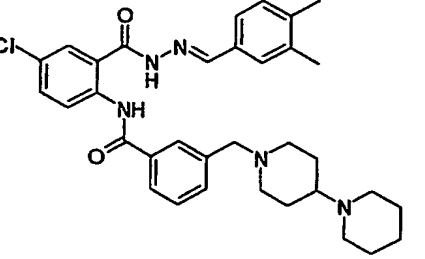
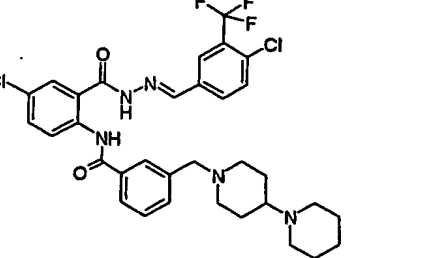
化合物343	
化合物344	
化合物345	
化合物346	
化合物347	

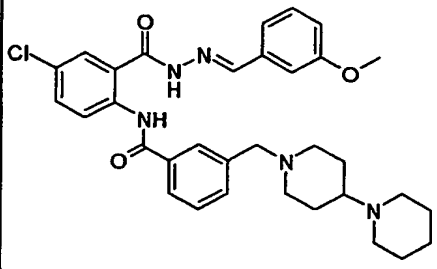
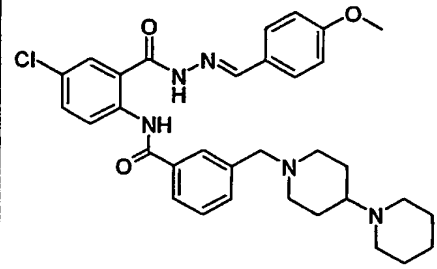
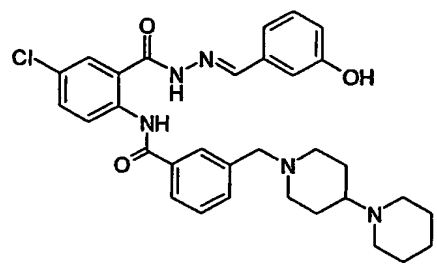
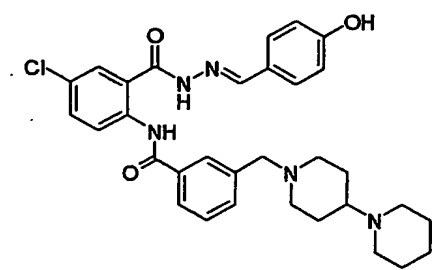
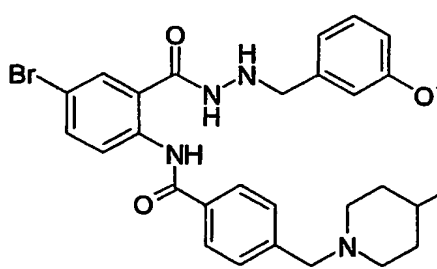
化合物348	
化合物349	
化合物350	
化合物351	
化合物352	

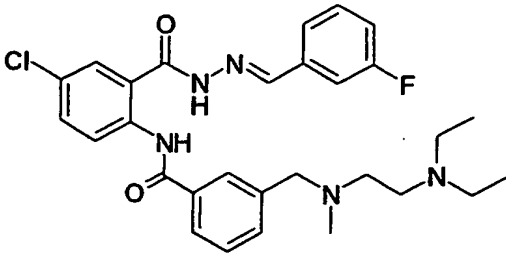
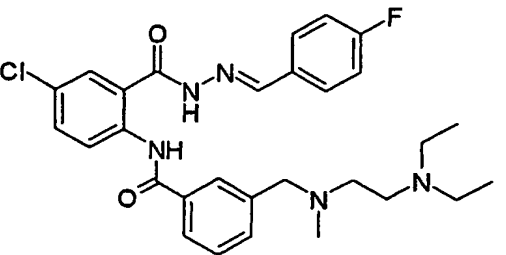
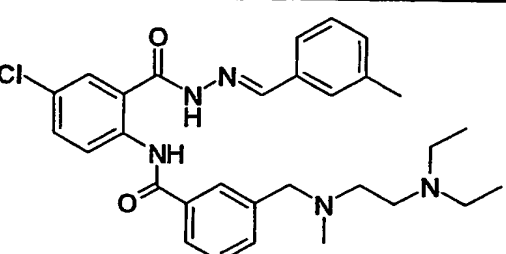
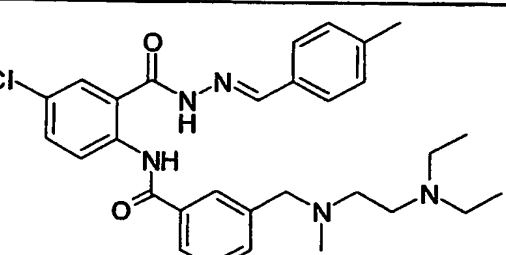
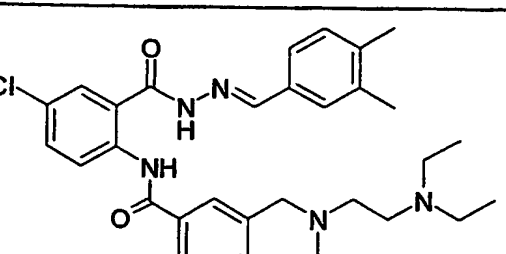
化合物353	
化合物354	
化合物355	
化合物356	 ClH
化合物357	

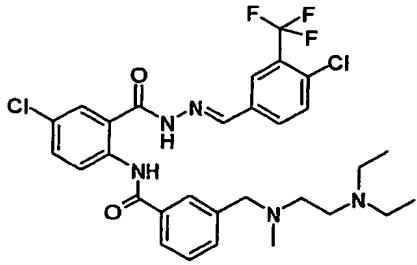
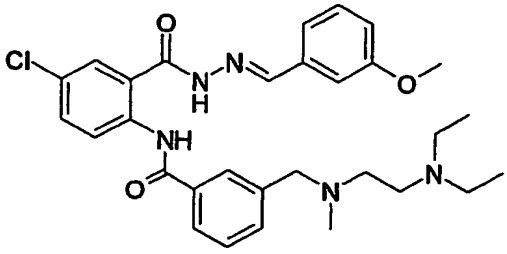
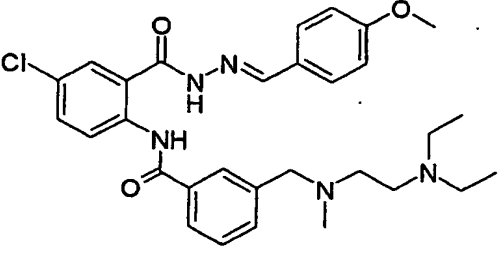
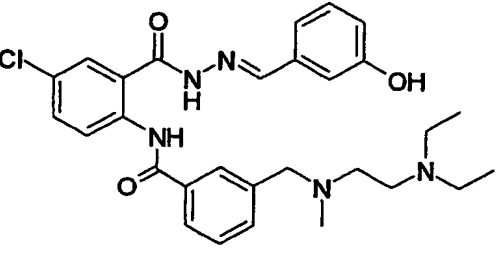
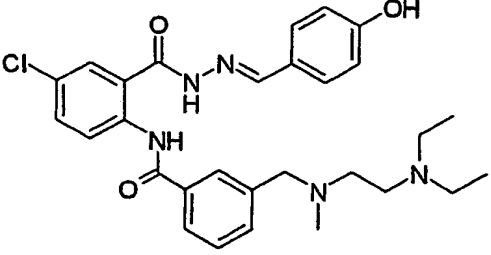
化合物358	
化合物359	
化合物360	
化合物361	
化合物362	

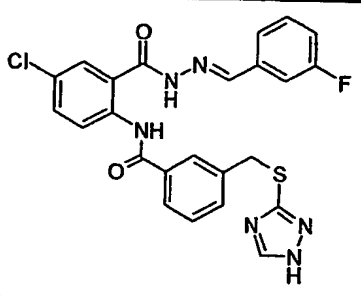
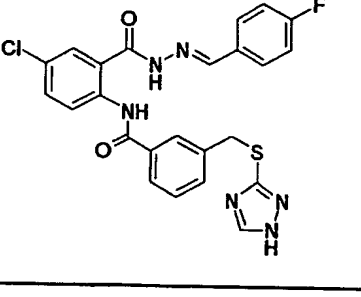
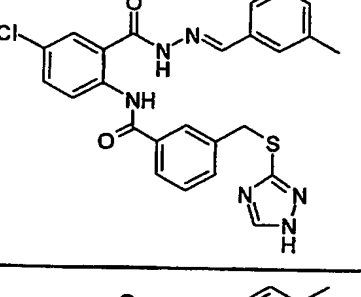
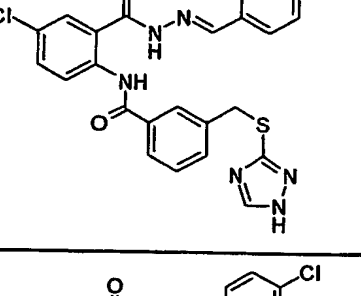
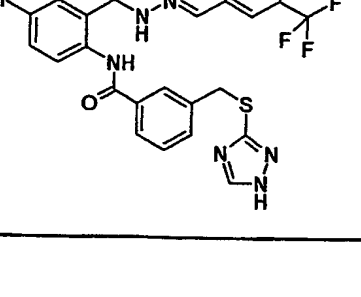
化合物363	
化合物364	
化合物366	
化合物367	
化合物368	

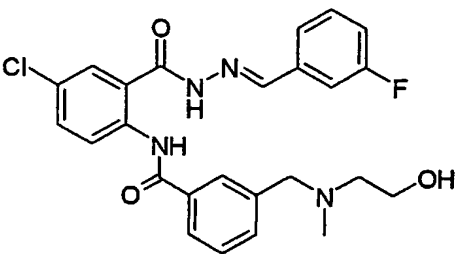
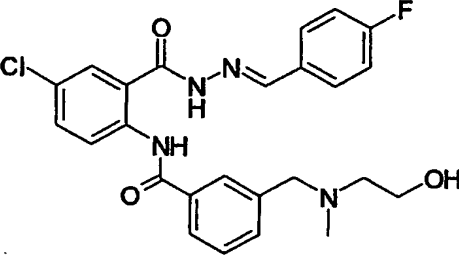
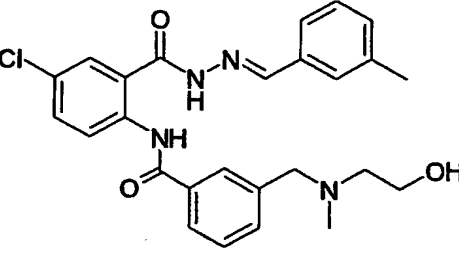
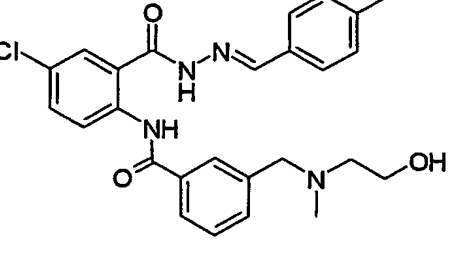
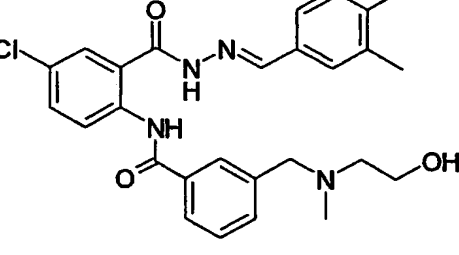
化合物369	
化合物370	
化合物371	
化合物372	
化合物373	

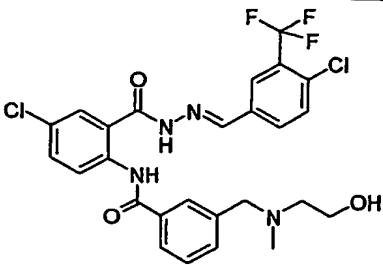
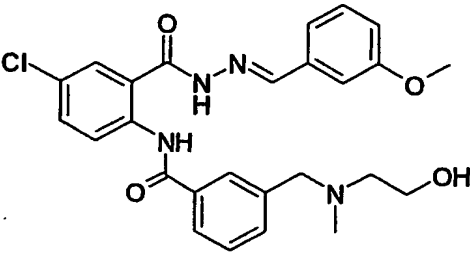
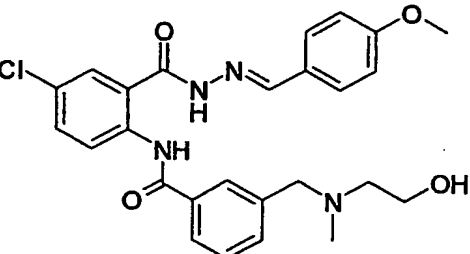
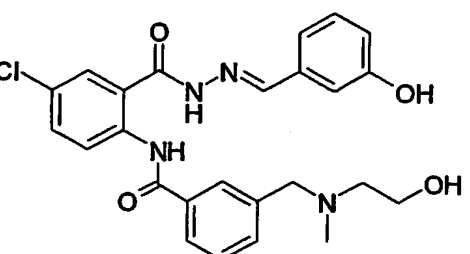
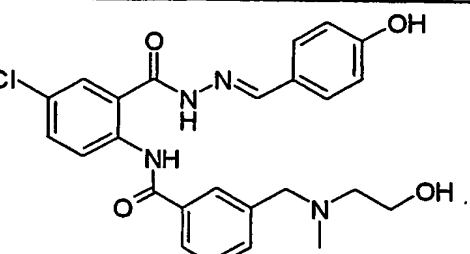
化合物374	
化合物375	
化合物376	
化合物377	
化合物378	

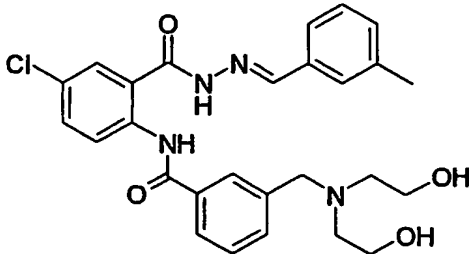
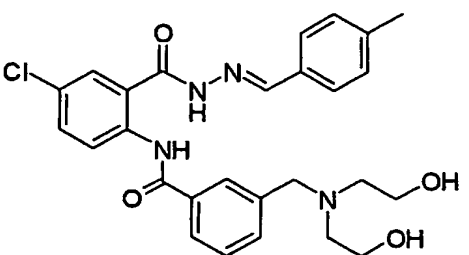
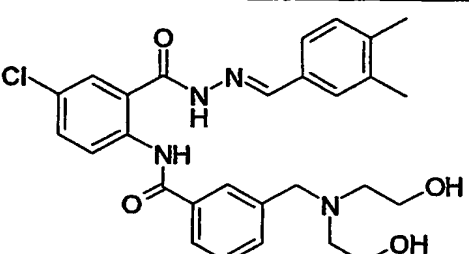
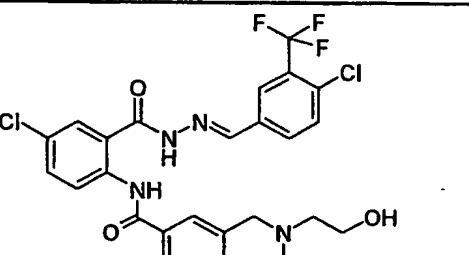
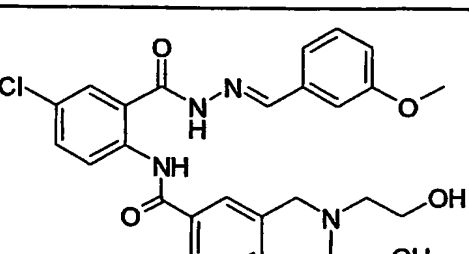
化合物379	
化合物380	
化合物381	
化合物382	
化合物383	

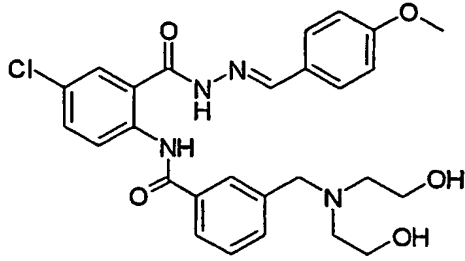
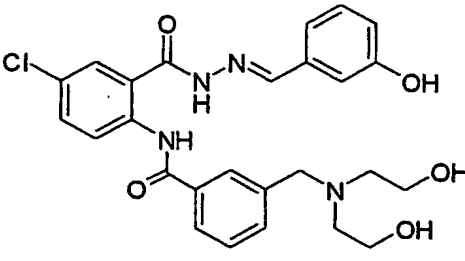
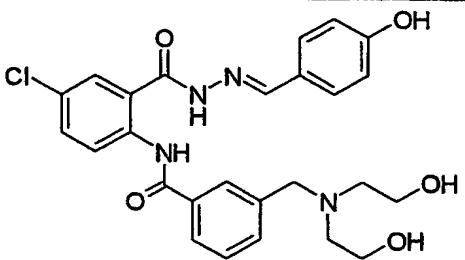
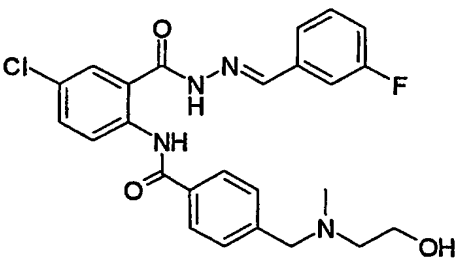
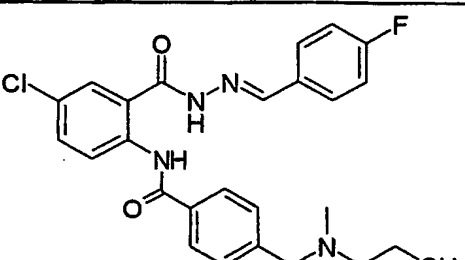
化合物384	
化合物385	
化合物386	
化合物387	
化合物388	

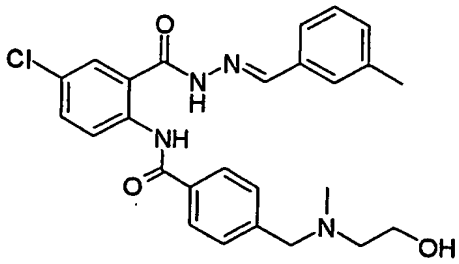
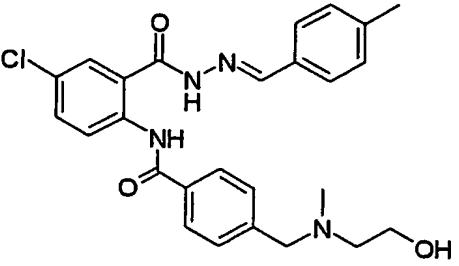
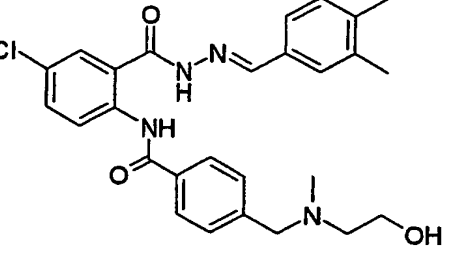
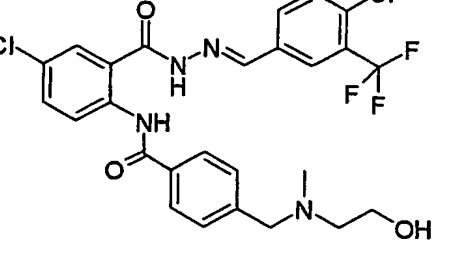
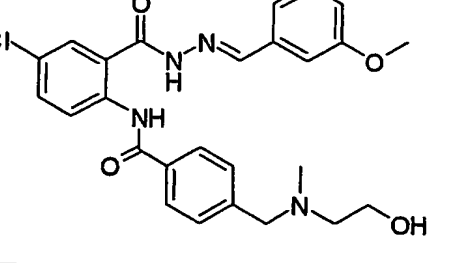
化合物389	
化合物390	
化合物391	
化合物392	
化合物393	

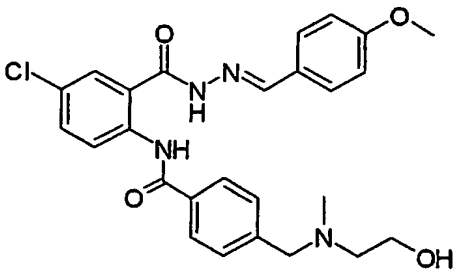
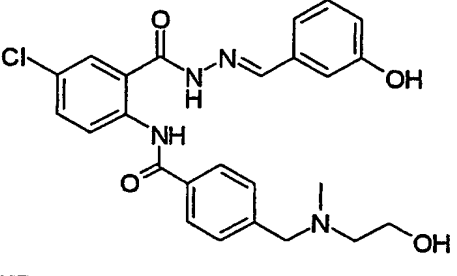
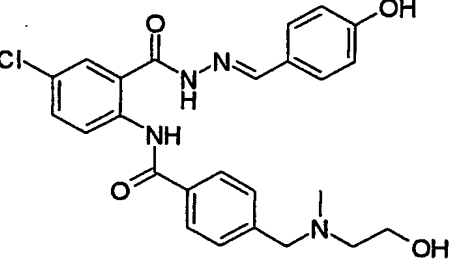
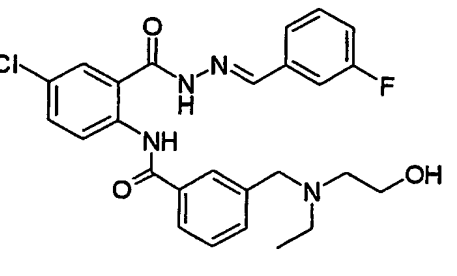
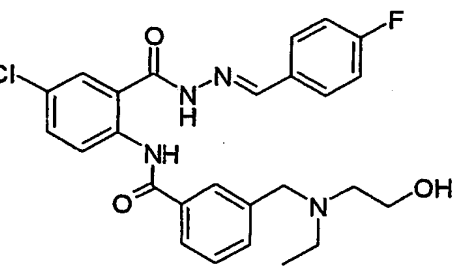
化合物394	
化合物395	
化合物396	
化合物397	
化合物398	

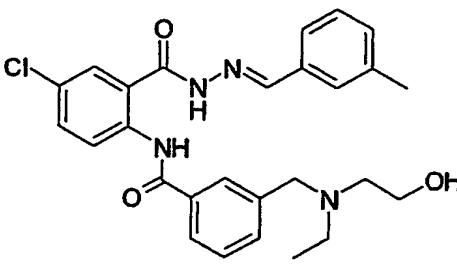
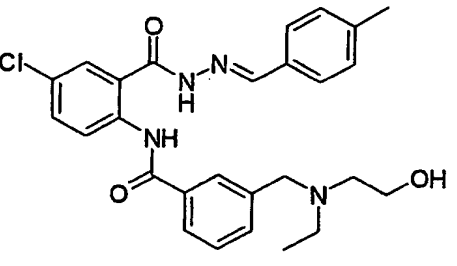
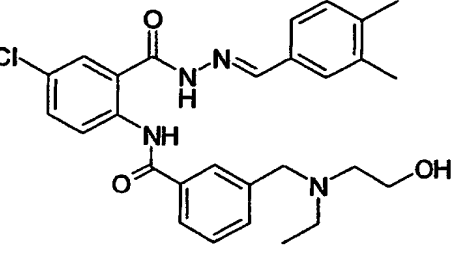
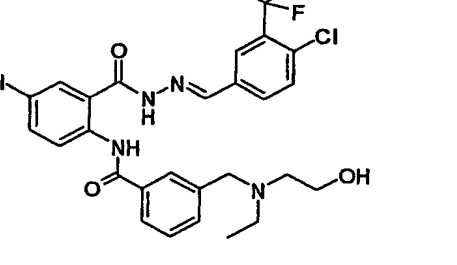
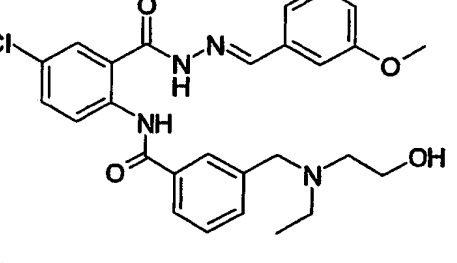
化合物399	
化合物400	
化合物401	
化合物402	
化合物403	

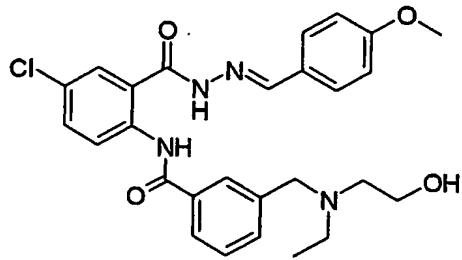
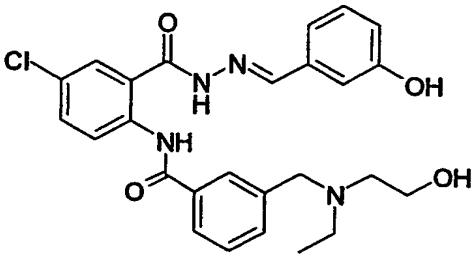
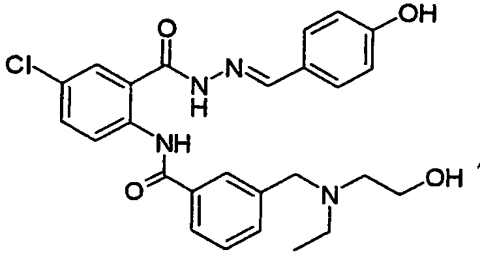
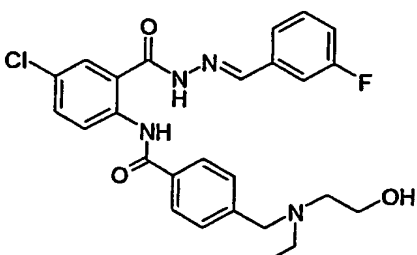
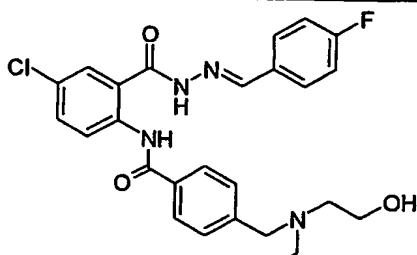
化合物404	
化合物405	
化合物406	
化合物407	
化合物408	

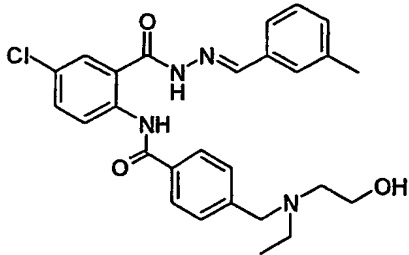
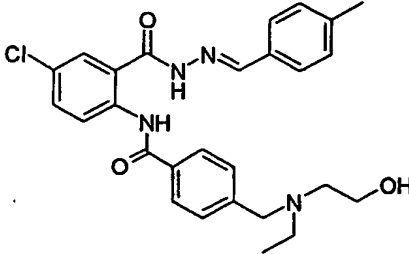
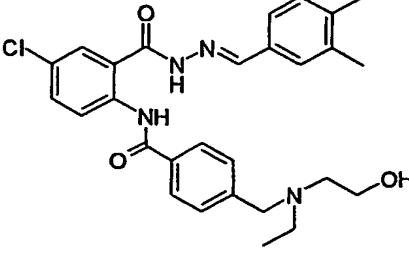
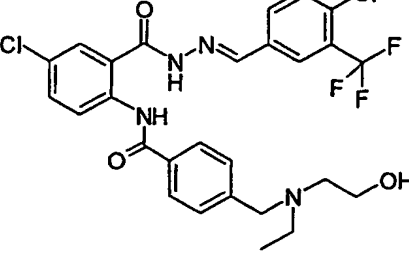
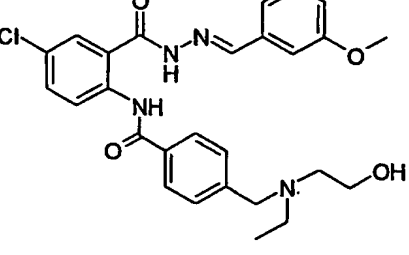
化合物409	
化合物410	
化合物411	
化合物412	
化合物413	

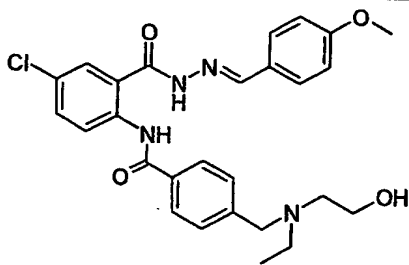
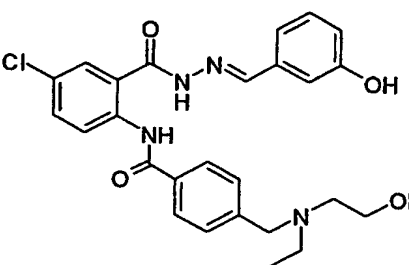
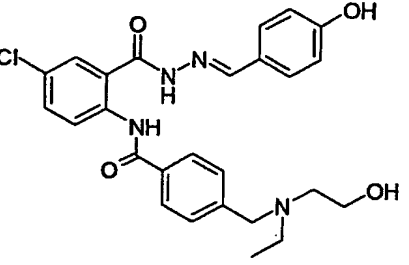
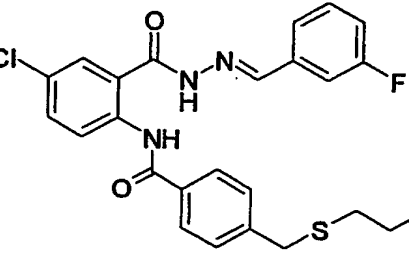
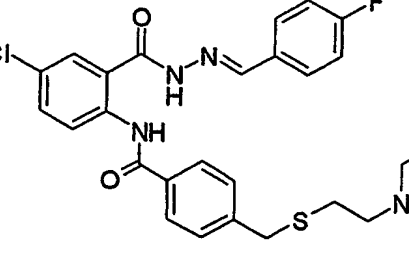
化合物414	
化合物415	
化合物416	
化合物417	
化合物418	

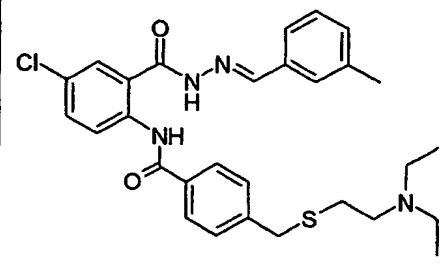
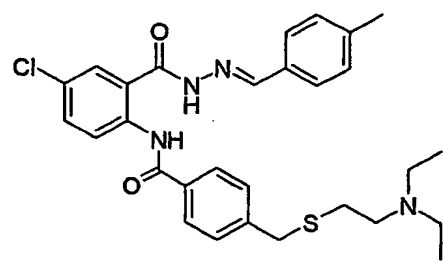
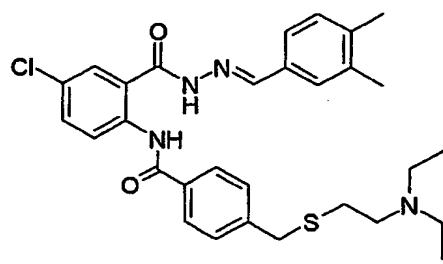
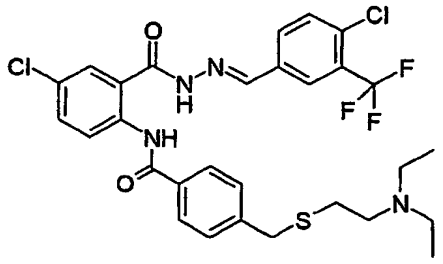
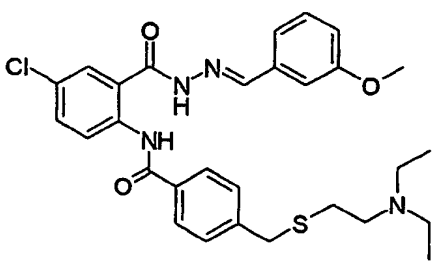
化合物419	
化合物420	
化合物421	
化合物422	
化合物423	

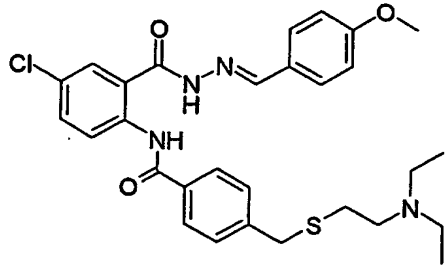
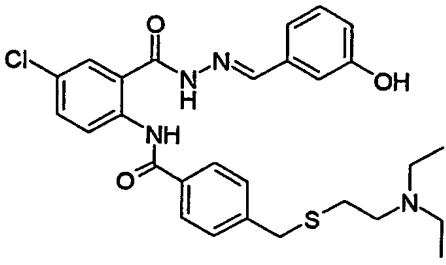
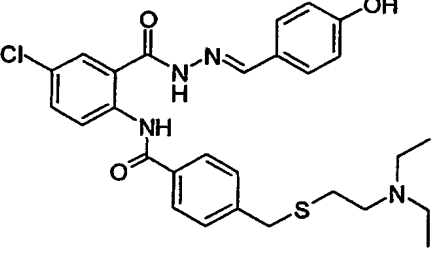
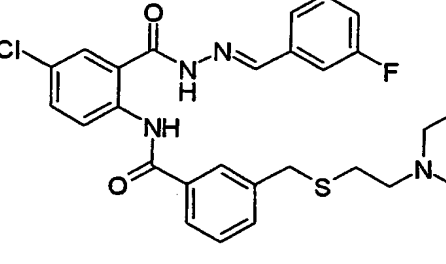
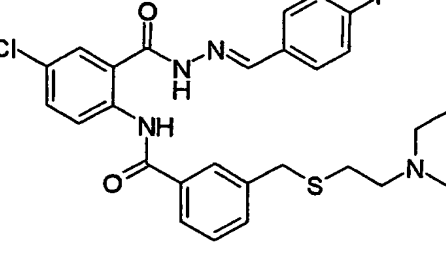
化合物424	
化合物425	
化合物426	
化合物427	
化合物428	

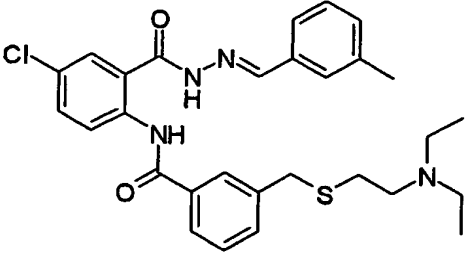
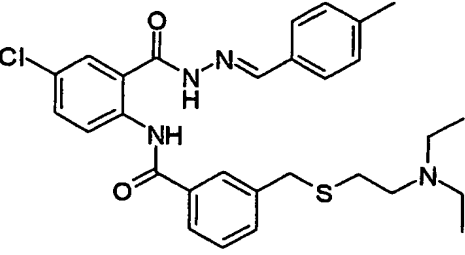
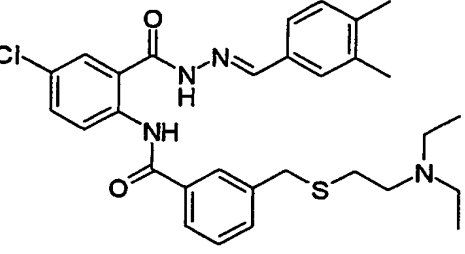
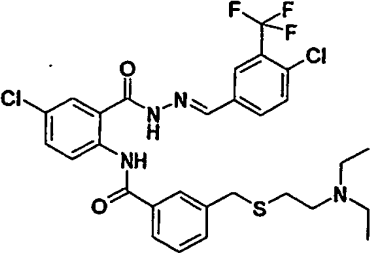
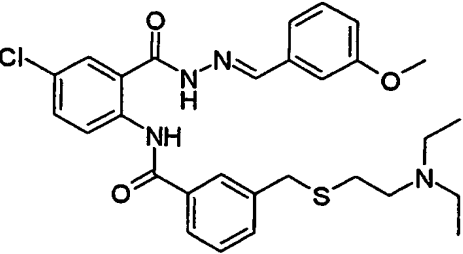
化合物429	
化合物430	
化合物431	
化合物432	
化合物433	

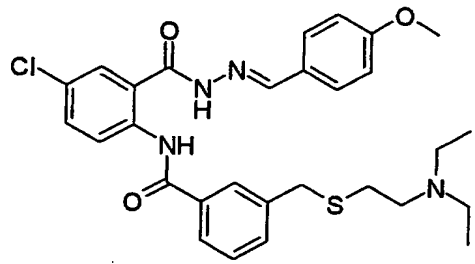
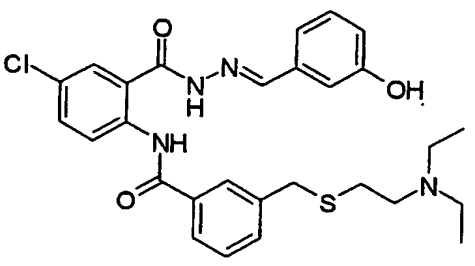
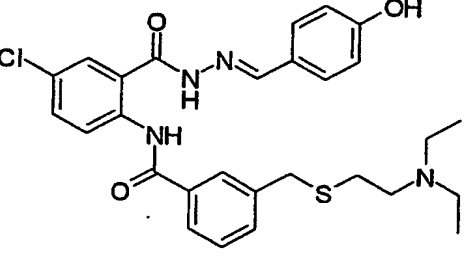
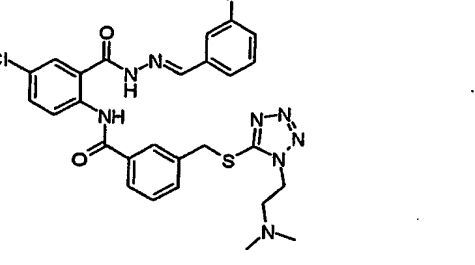
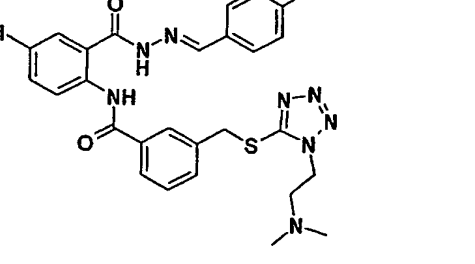
化合物434	
化合物435	
化合物436	
化合物437	
化合物438	

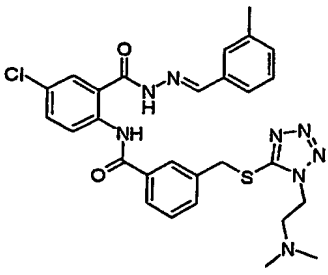
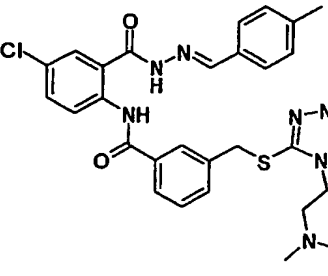
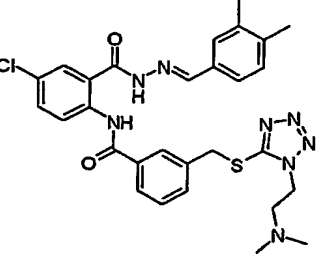
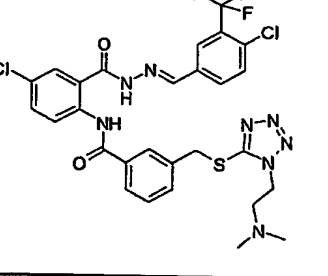
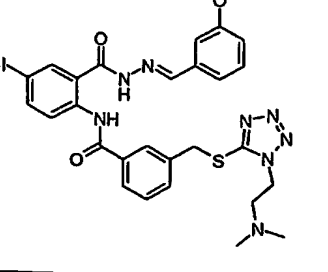
化合物439	
化合物440	
化合物441	
化合物442	
化合物443	

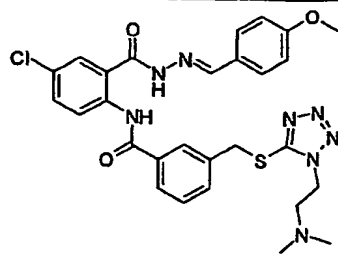
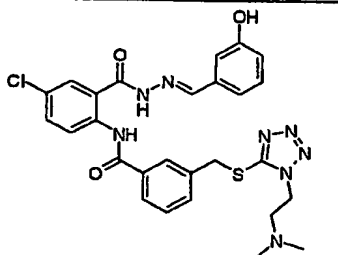
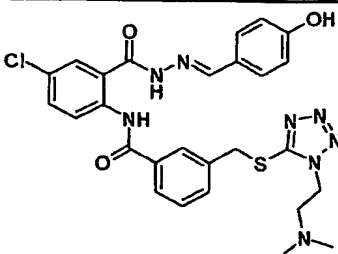
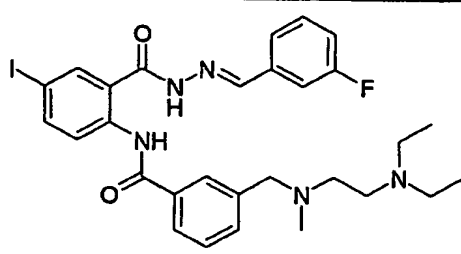
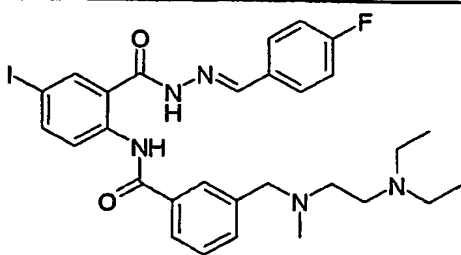
化合物444	
化合物445	
化合物446	
化合物447	
化合物448	

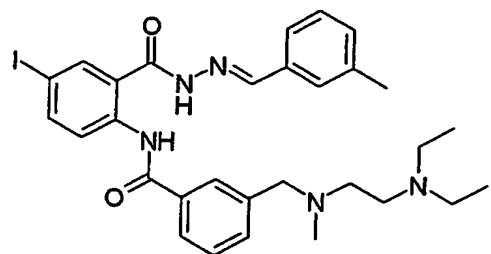
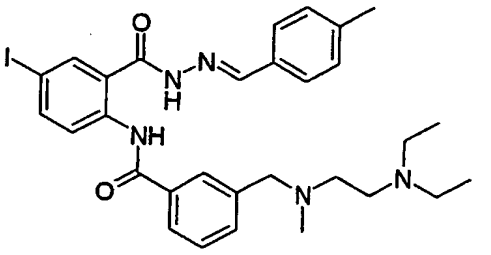
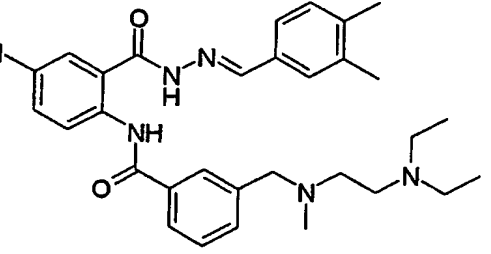
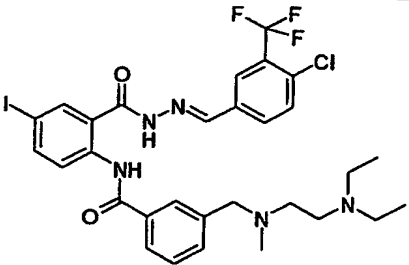
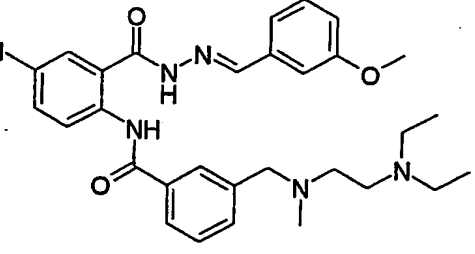
化合物449	
化合物450	
化合物451	
化合物452	
化合物453	

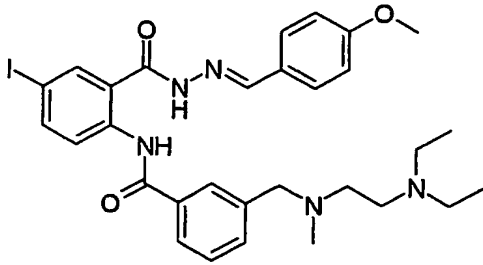
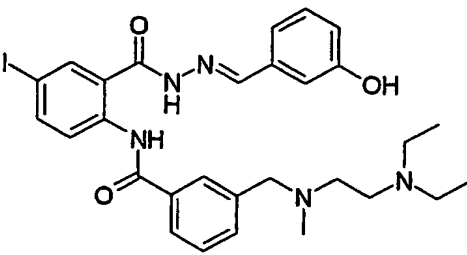
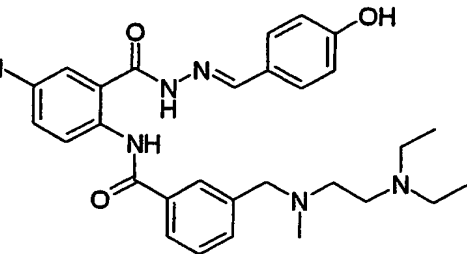
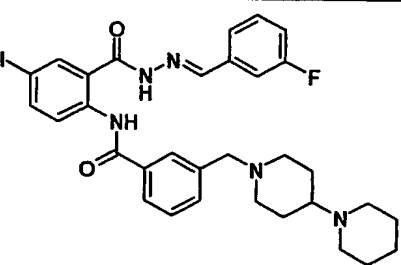
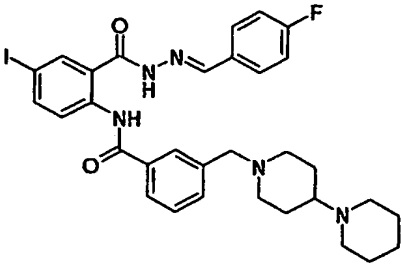
化合物454	
化合物455	
化合物456	
化合物457	
化合物458	

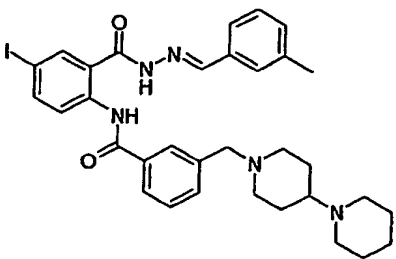
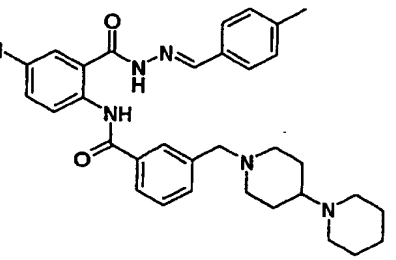
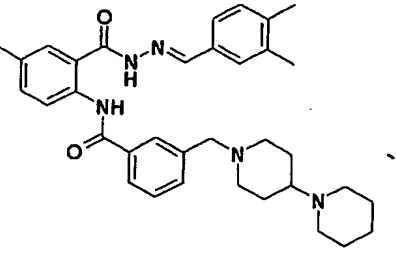
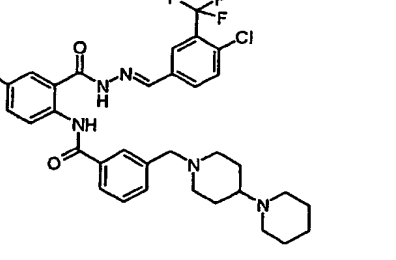
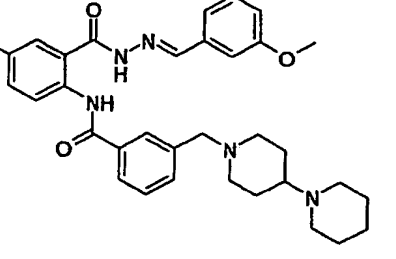
化合物459	
化合物460	
化合物461	
化合物462	
化合物463	

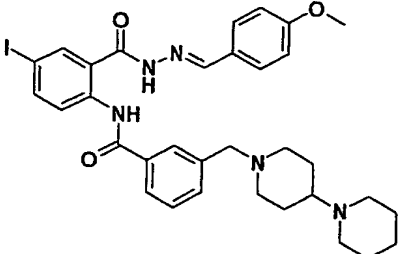
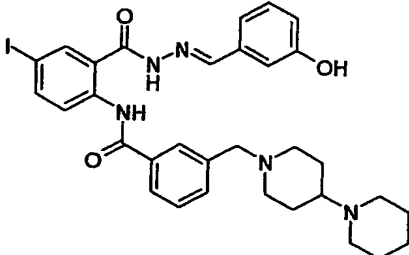
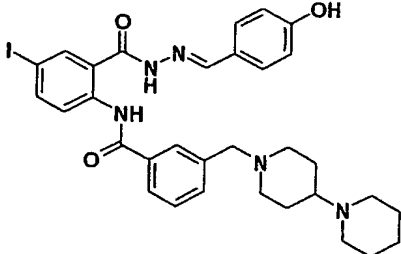
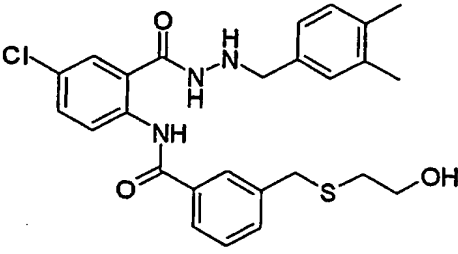
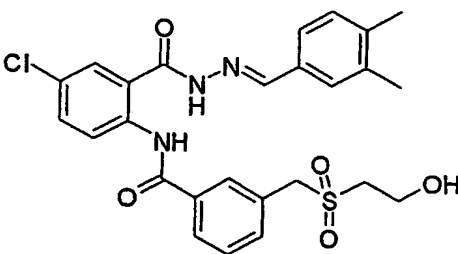
化合物464	
化合物465	
化合物466	
化合物467	
化合物468	

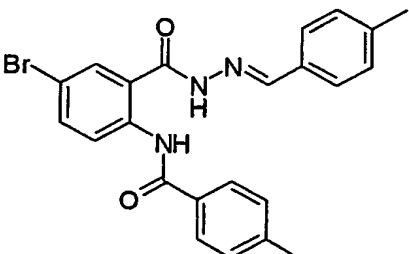
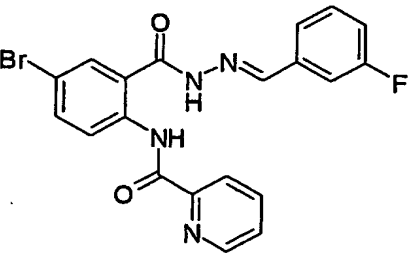
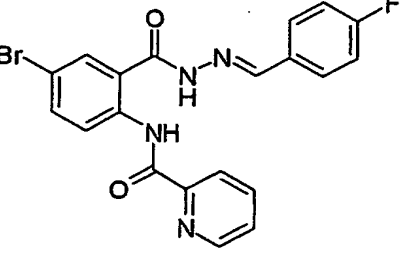
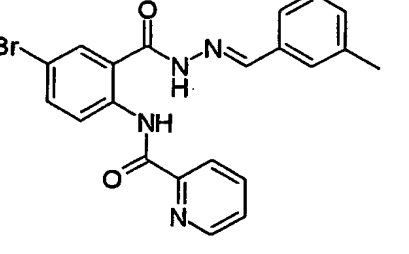
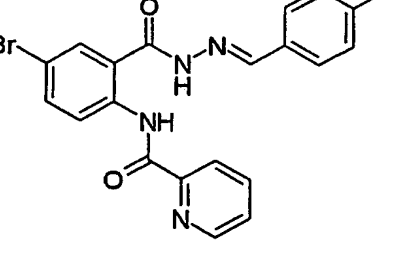
化合物469	
化合物470	
化合物471	
化合物472	
化合物473	

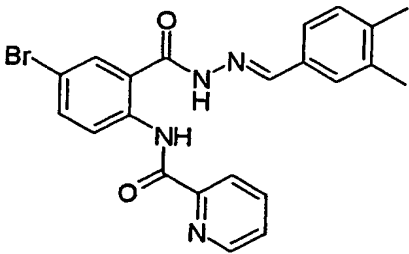
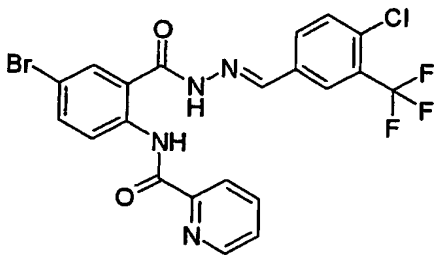
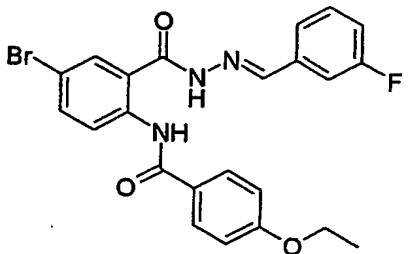
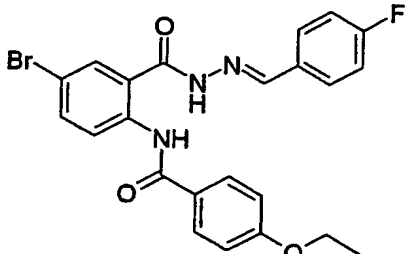
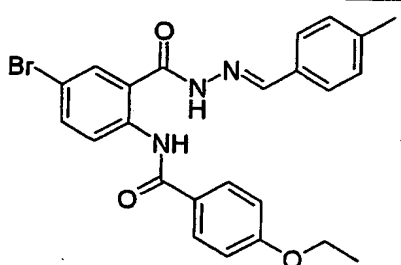
化合物474	
化合物475	
化合物476	
化合物477	
化合物478	

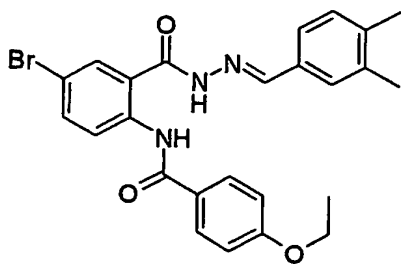
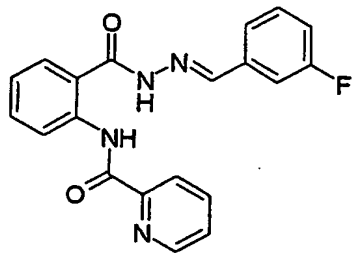
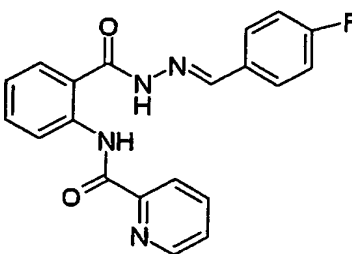
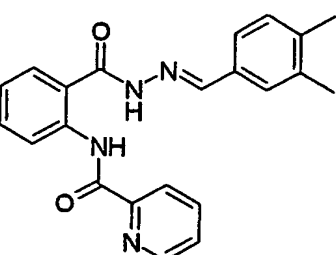
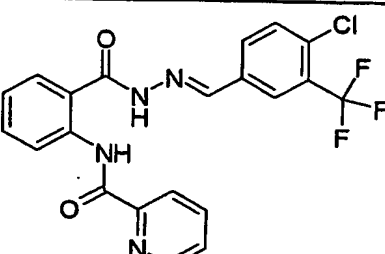
化合物479	
化合物480	
化合物481	
化合物482	
化合物483	

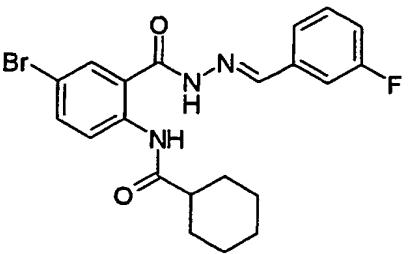
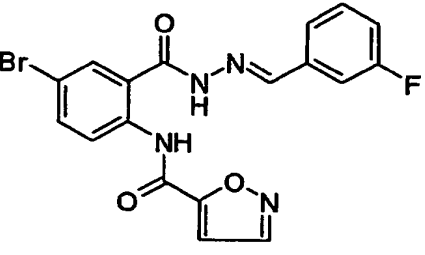
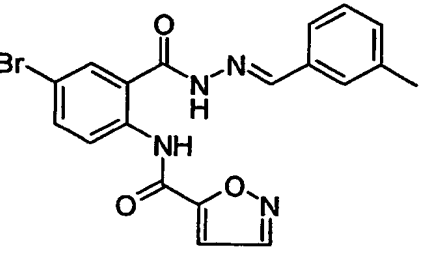
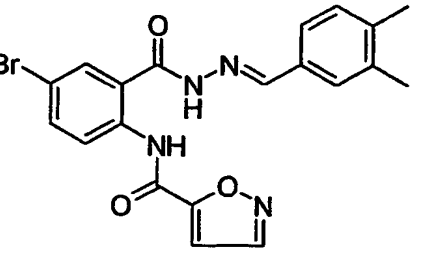
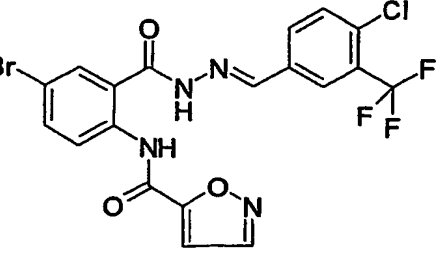
化合物484	
化合物485	
化合物486	
化合物487	
化合物488	

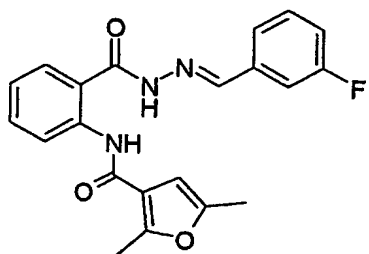
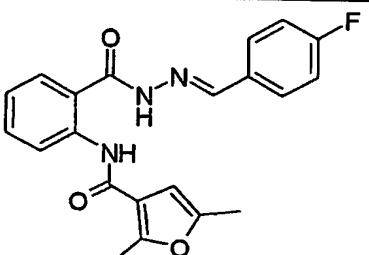
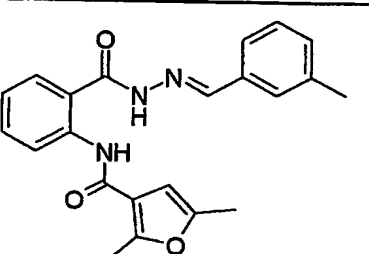
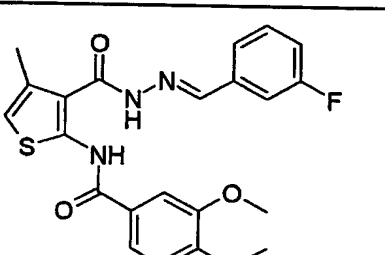
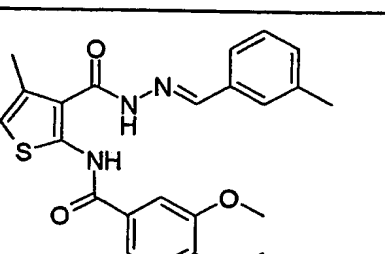
化合物489	
化合物490	
化合物491	
化合物492	
化合物493	

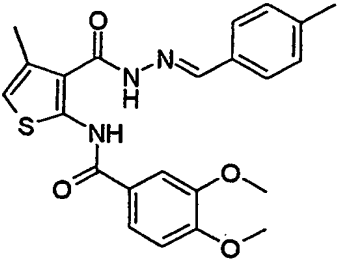
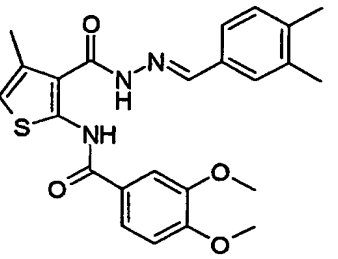
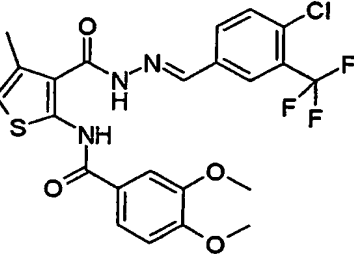
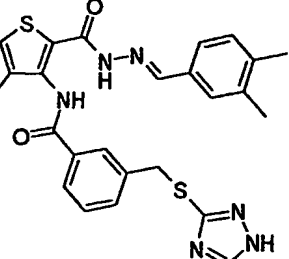
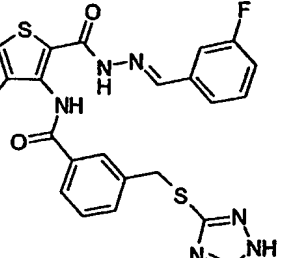
化合物494	
化合物495	
化合物496	
化合物497	
化合物498	

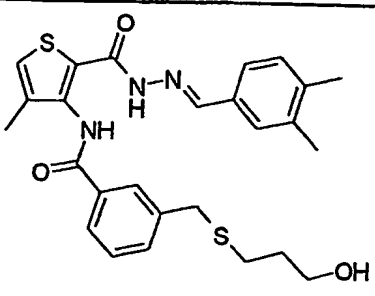
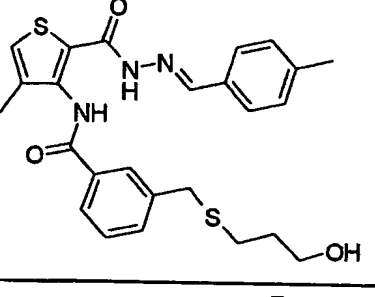
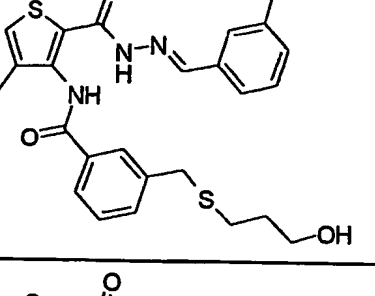
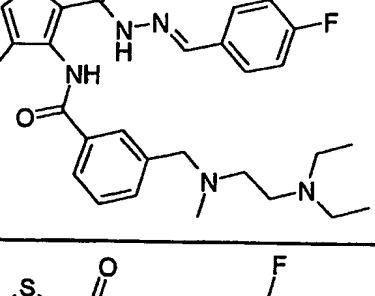
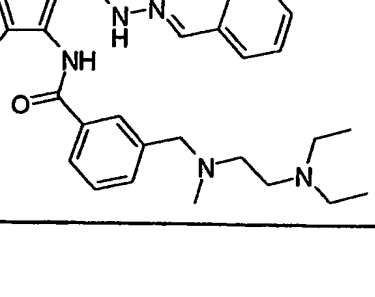
化合物499	
化合物500	
化合物501	
化合物502	
化合物503	

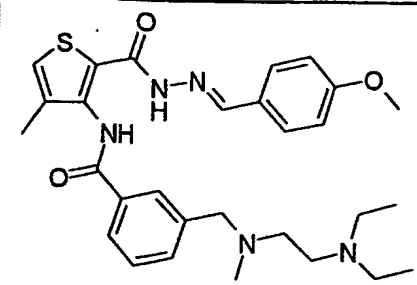
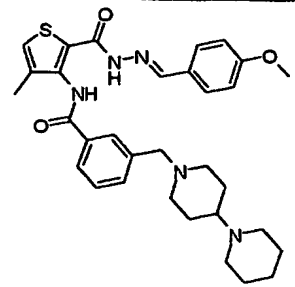
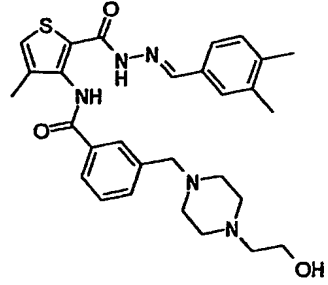
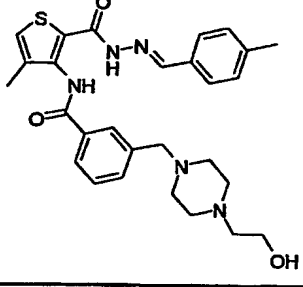
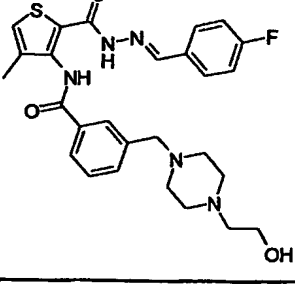
化合物504	
化合物505	
化合物506	
化合物507	
化合物508	

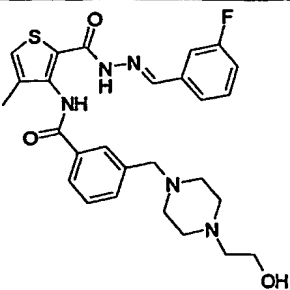
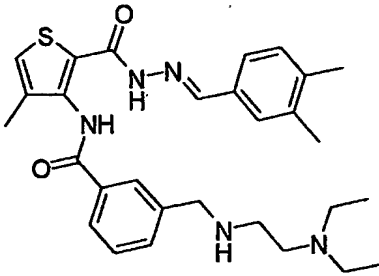
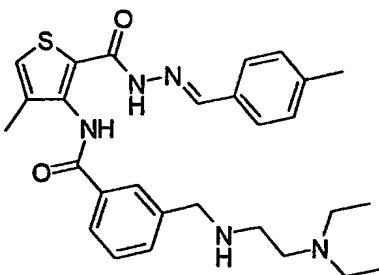
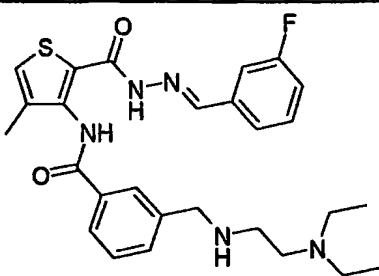
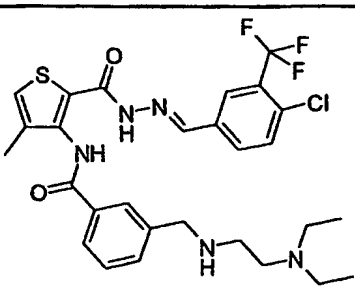
化合物509	
化合物510	
化合物511	
化合物512	
化合物513	

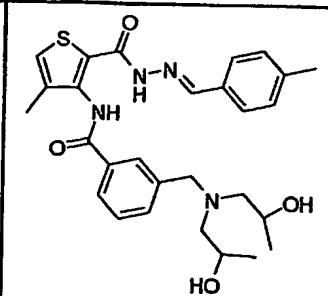
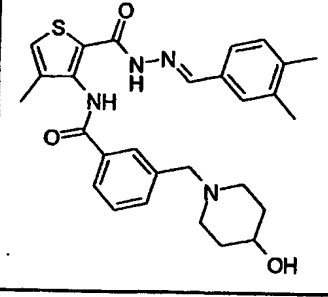
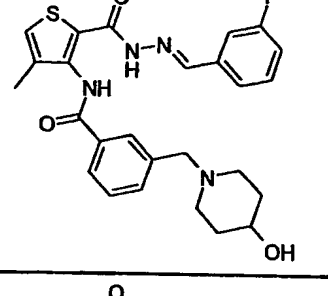
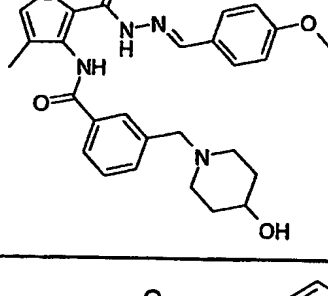
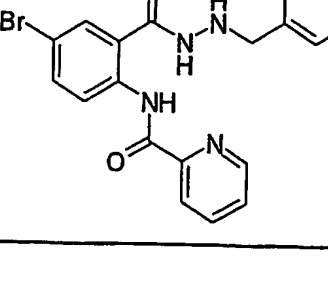
化合物514	 <chem>CC1=CC(OC)=C(C(=O)Nc2ccccc2C(=O)N=Nc3ccc(F)cc3)C=C1</chem>
化合物515	 <chem>CC1=CC(OC)=C(C(=O)Nc2ccccc2C(=O)N=Nc3ccc(F)cc3)C=C1</chem>
化合物516	 <chem>CC1=CC(OC)=C(C(=O)Nc2ccccc2C(=O)N=Nc3ccc(C)cc3)C=C1</chem>
化合物517	 <chem>CC1=CC(OC)=C(C(=O)Nc2cc3ccsc3C(=O)Nc4ccccc4C(=O)N=Nc5ccc(F)cc5)C=C1</chem>
化合物518	 <chem>CC1=CC(OC)=C(C(=O)Nc2cc3ccsc3C(=O)Nc4cc5ccccc5C(=O)N=Nc6ccc(C)cc6)C=C1</chem>

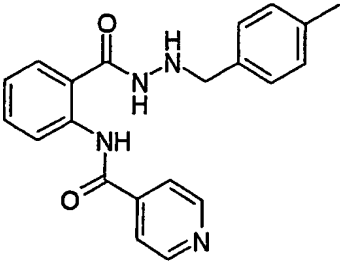
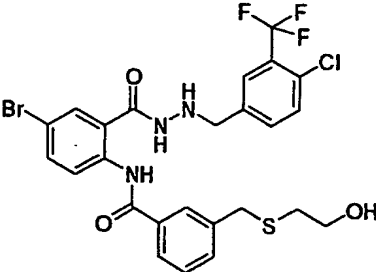
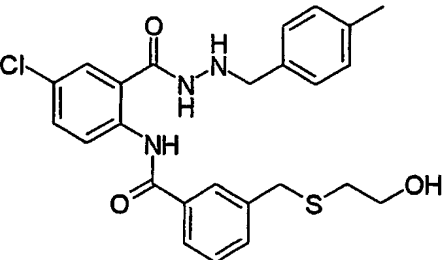
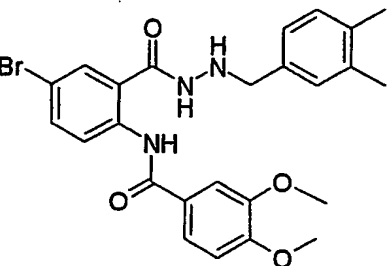
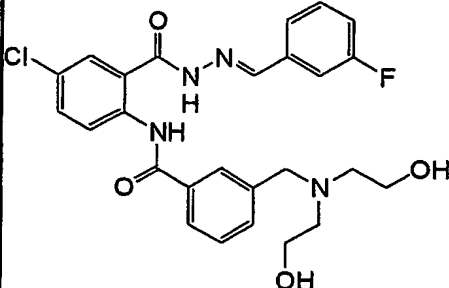
化合物519	
化合物521	
化合物522	
化合物523	
化合物524	

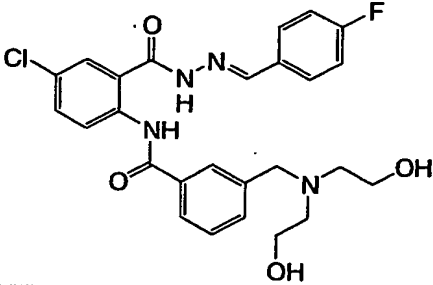
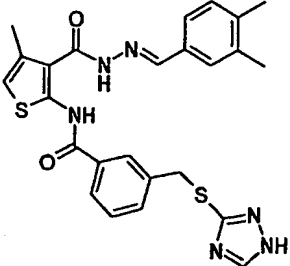
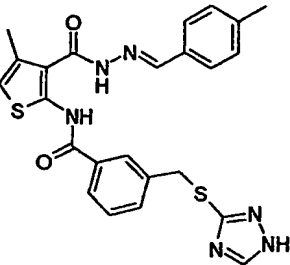
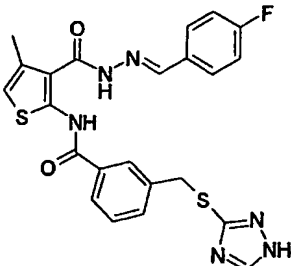
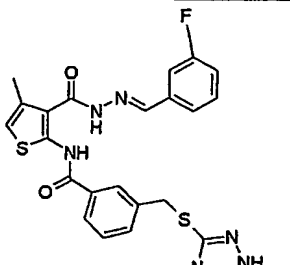
化合物525	
化合物526	
化合物527	
化合物528	
化合物529	

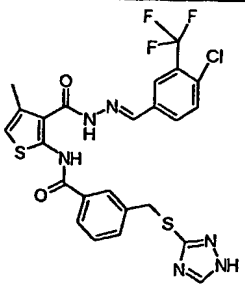
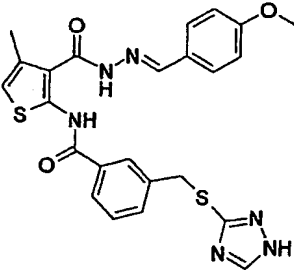
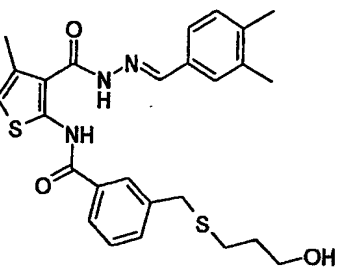
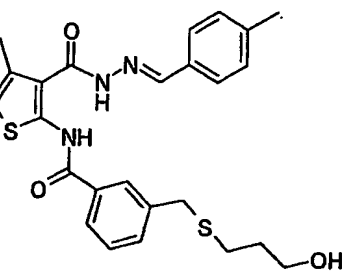
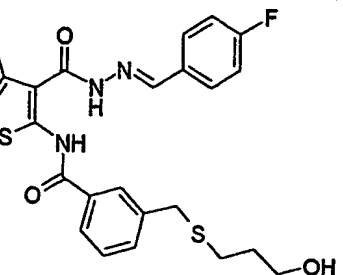
化合物530	 <chem>CCN(CC)CCN(Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)cc3c2=O)/N=N/C=C/c4ccc(OC)cc4</chem>
化合物531	 <chem>C1CCN(C1)C2CCN(C2)Cc3ccc(cc3)C(=O)Nc4cc5sc(C)cc5c4=O</chem>
化合物532	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2cc3sc(C)cc3c2=O</chem> <chem>CCOCCN1CCN(C1)Cc2ccc(cc2)C(=O)Nc3cc4sc(C)cc4c3=O</chem>
化合物533	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2cc3sc(C)cc3c2=O</chem> <chem>CCOCCN1CCN(C1)Cc2ccc(cc2)C(=O)Nc3cc4sc(C)cc4c3=O</chem>
化合物534	 <chem>Fc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)cc3c2=O</chem> <chem>CCOCCN1CCN(C1)Cc2ccc(cc2)C(=O)Nc3cc4sc(C)cc4c3=O</chem>

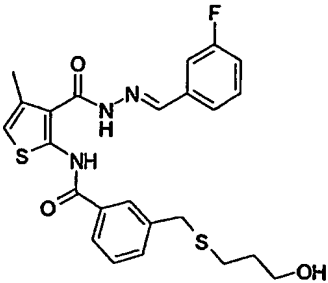
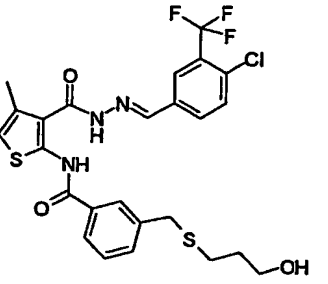
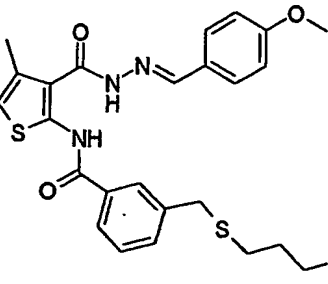
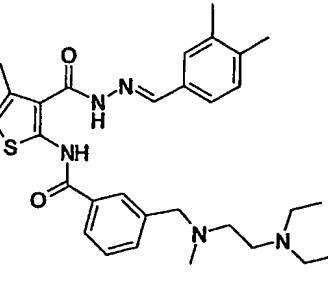
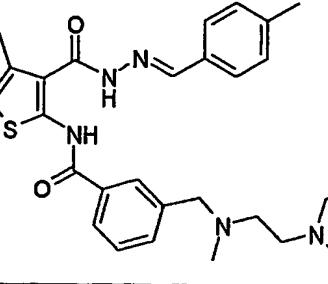
化合物535	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C(=O)Nc2cc(C)s2C(=O)NN=Cc3ccc(F)cc3)CN4CCN(CC4)CCO</chem>
化合物536	 <chem>CCN(CC)CCNCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(C)s2C(=O)NN=Cc3ccc(C)cc3</chem>
化合物537	 <chem>CCN(CC)CCNCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(C)s2C(=O)NN=Cc3ccc(C)cc3</chem>
化合物538	 <chem>CCN(CC)CCNCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(C)s2C(=O)NN=Cc3ccc(F)cc3</chem>
化合物539	 <chem>CCN(CC)CCNCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(C)s2C(=O)NN=Cc3cc(Cl)c(C(F)(F)F)cc3</chem>

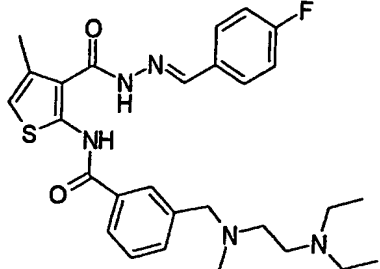
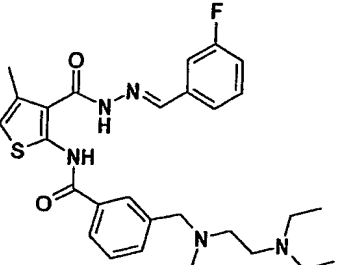
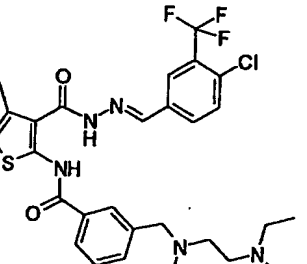
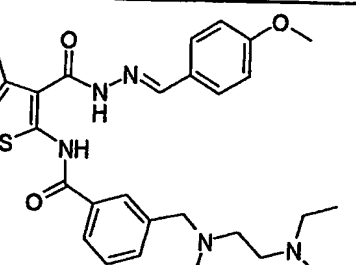
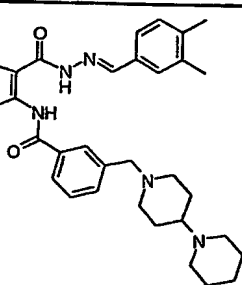
化合物540	
化合物541	
化合物542	
化合物543	
化合物544	

化合物545	
化合物546	
化合物547	
化合物548	
化合物549	

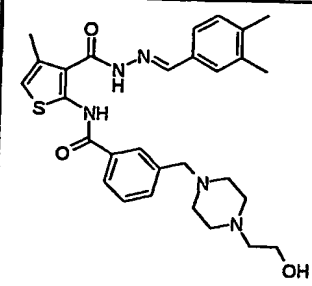
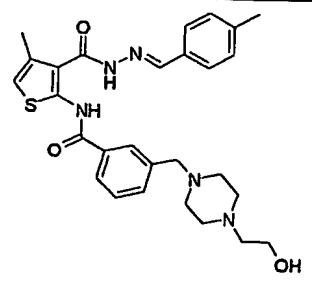
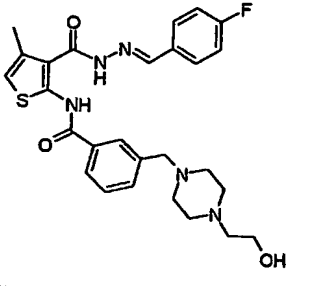
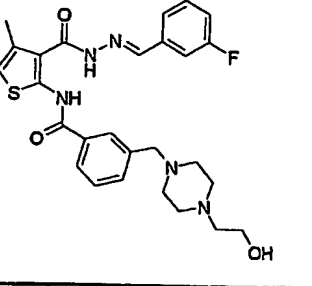
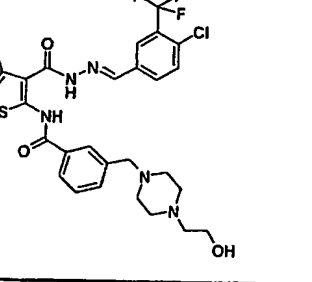
化合物550	
化合物551	
化合物552	
化合物553	
化合物554	

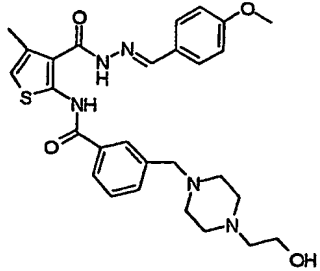
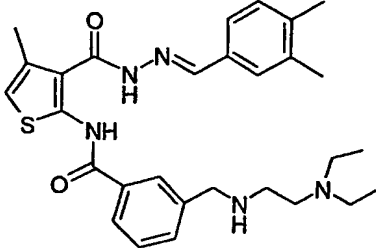
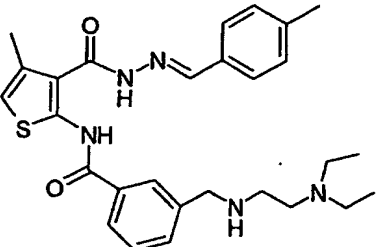
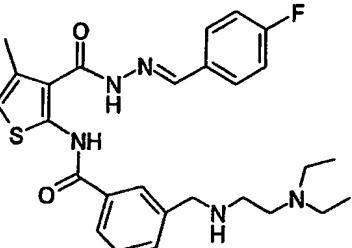
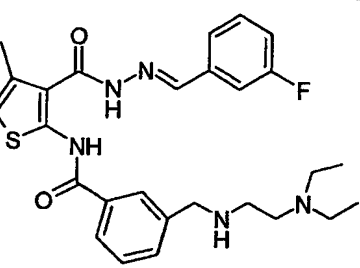
化合物555	
化合物556	
化合物557	
化合物558	
化合物559	

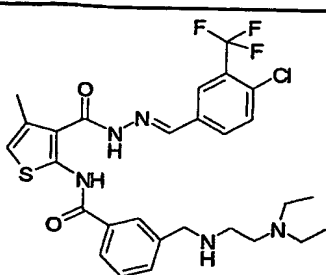
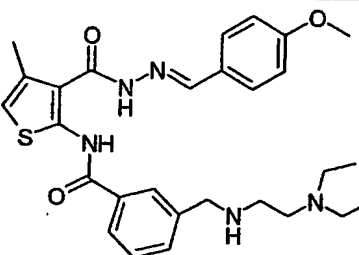
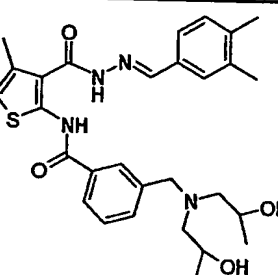
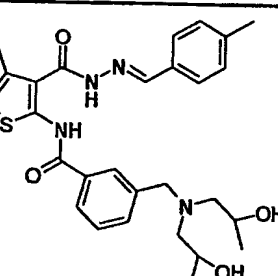
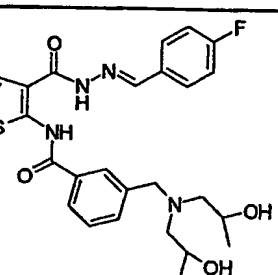
化合物560	
化合物561	
化合物562	
化合物563	
化合物564	

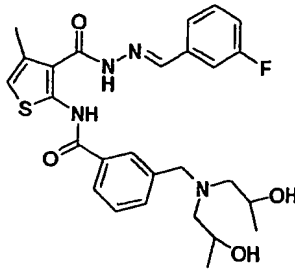
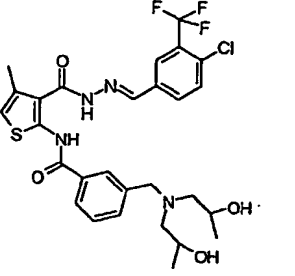
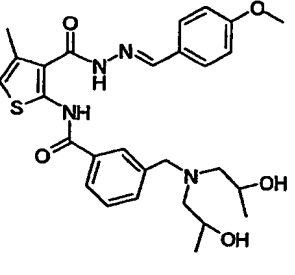
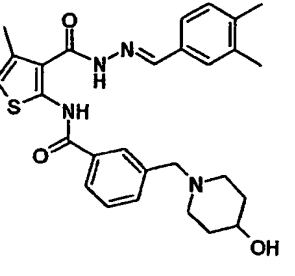
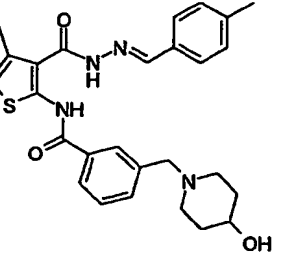
化合物565	
化合物566	
化合物567	
化合物568	
化合物569	

[illegible]

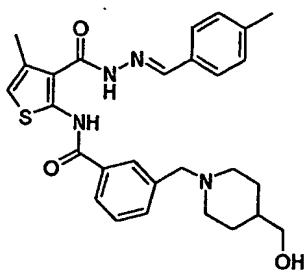
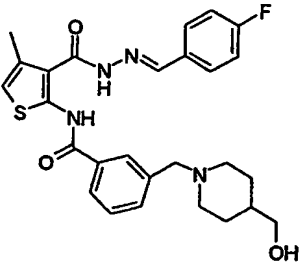
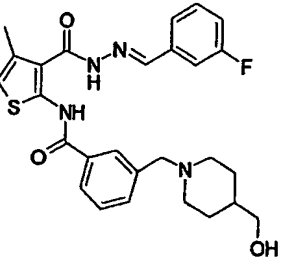
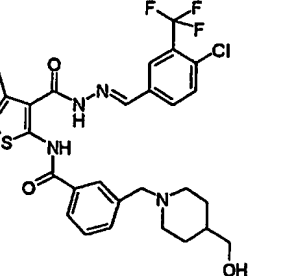
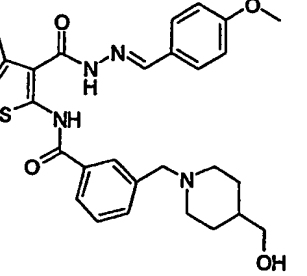
化合物575	
化合物576	
化合物577	
化合物578	
化合物579	

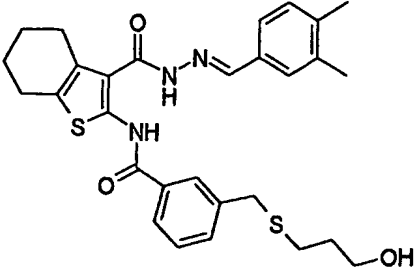
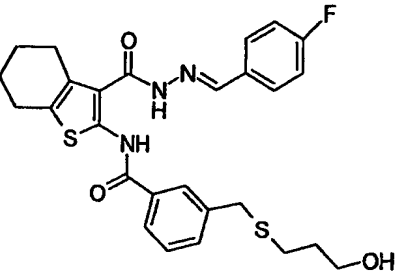
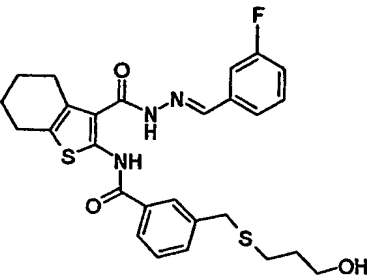
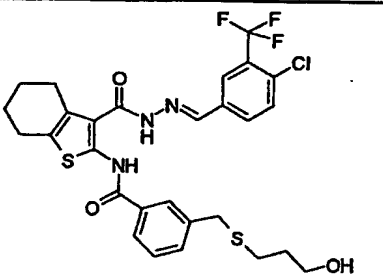
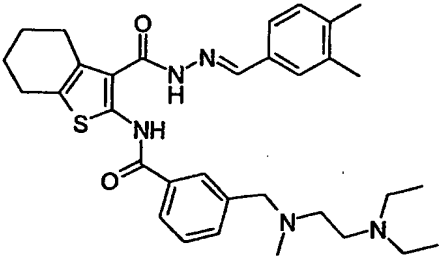
化合物580	 <chem>COc1ccc(cc1)/N=N/C(=O)c2cc3c(s2)nc(NC(=O)c4ccc(cc4)CN5CCN(CC5)CCO)cc3</chem>
化合物581	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)/N=N/C(=O)c2cc3c(s2)nc(NC(=O)c4ccccc4CNCCN(CC)CC)cc3</chem>
化合物582	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)/N=N/C(=O)c2cc3c(s2)nc(NC(=O)c4ccccc4CNCCN(CC)CC)cc3</chem>
化合物583	 <chem>Fc1ccc(cc1)/N=N/C(=O)c2cc3c(s2)nc(NC(=O)c4ccccc4CNCCN(CC)CC)cc3</chem>
化合物584	 <chem>Fc1cccc(c1)/N=N/C(=O)c2cc3c(s2)nc(NC(=O)c4ccccc4CNCCN(CC)CC)cc3</chem>

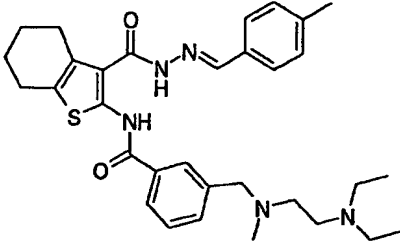
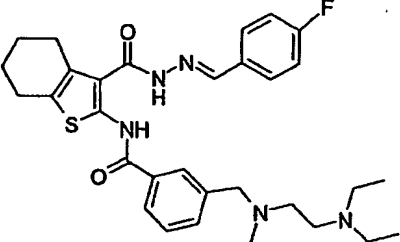
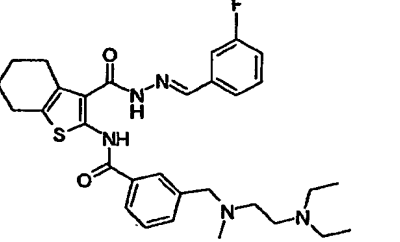
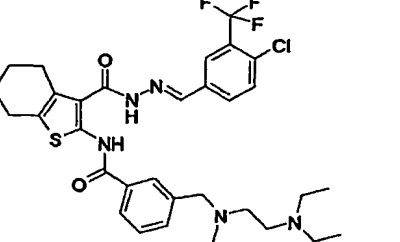
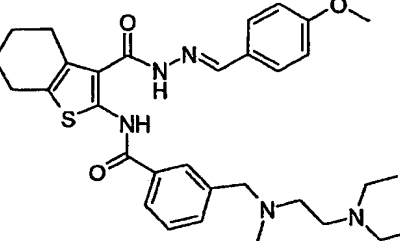
化合物585	 <chem>CCN(CC)CCNC(c1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)c(C(=O)Nc4ccc(cc4)C(F)(F)Cl)cc3n2)c5ccccc5C(=O)c6ccccc6</chem>
化合物586	 <chem>CCN(CC)CCNC(c1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)c(C(=O)Nc4ccc(cc4)CO)cc3n2)c5ccccc5C(=O)c6ccccc6</chem>
化合物587	 <chem>CC(C)C(O)CN(C(C)C(O))Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)c(C(=O)Nc4cc(C)c(C)cc4)cc3n2</chem>
化合物588	 <chem>CC(C)C(O)CN(C(C)C(O))Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)c(C(=O)Nc4ccc(cc4)C)cc3n2</chem>
化合物589	 <chem>CC(C)C(O)CN(C(C)C(O))Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3sc(C)c(C(=O)Nc4ccc(cc4)F)cc3n2</chem>

化合物590	
化合物591	
化合物592	
化合物593	
化合物594	

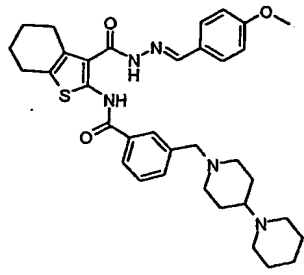
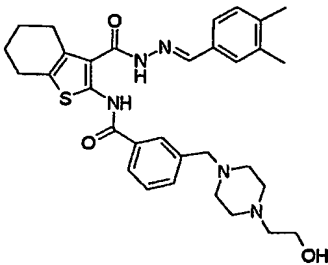
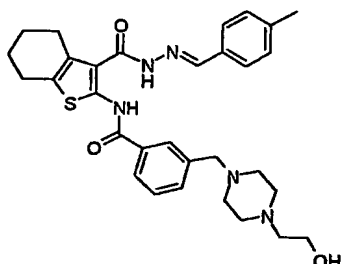
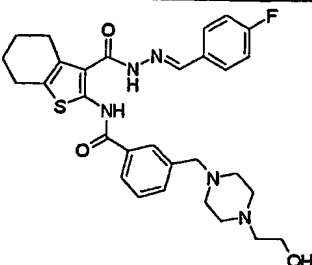
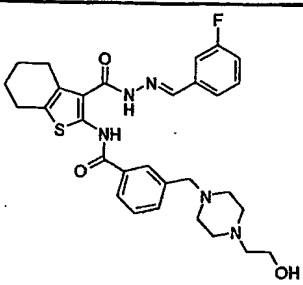
化合物595	
化合物596	
化合物597	
化合物598	
化合物599	

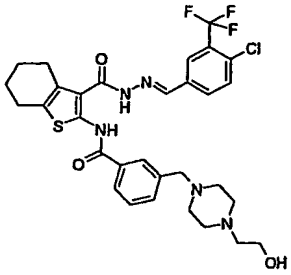
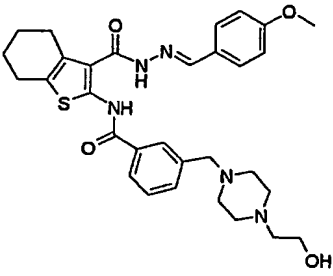
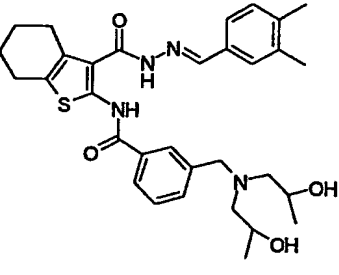
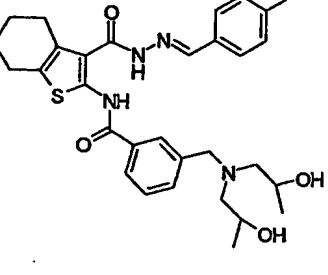
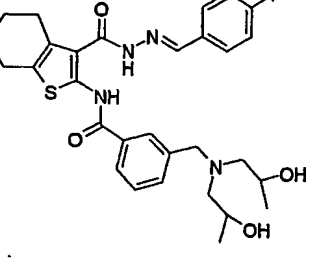
化合物600	
化合物601	
化合物602	
化合物603	
化合物604	

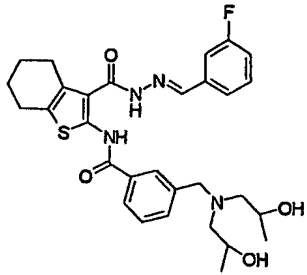
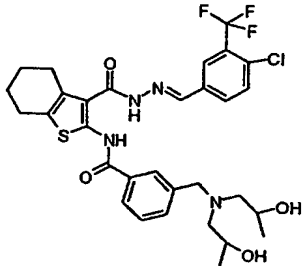
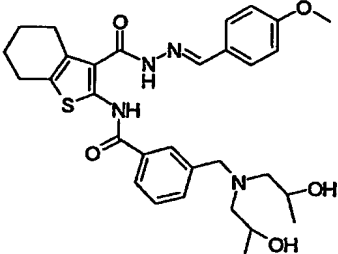
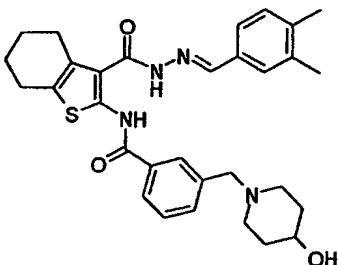
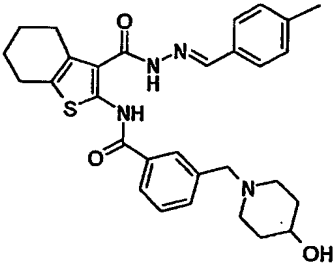
化合物605	
化合物606	
化合物607	
化合物608	
化合物609	

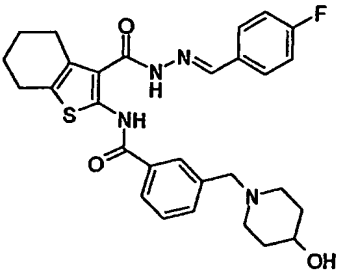
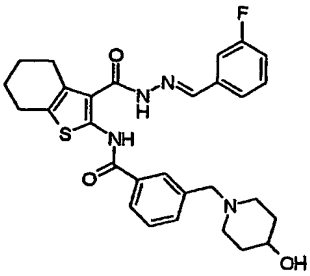
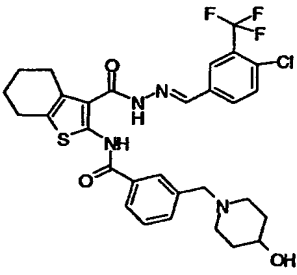
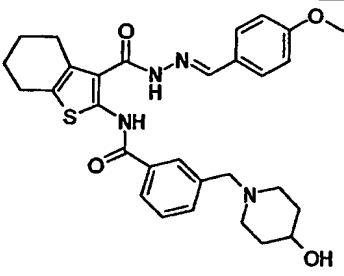
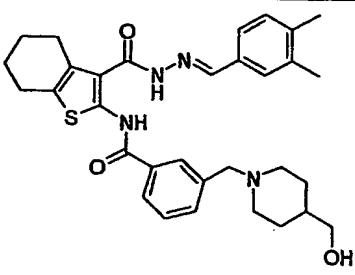
化合物610	 <chem>CCN(CC)CCN(C)Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2c3c(s2)C4CCCCC4C(=O)Nc5ccc(C)cc5</chem>
化合物611	 <chem>CCN(CC)CCN(C)Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2c3c(s2)C4CCCCC4C(=O)Nc5ccc(F)cc5</chem>
化合物612	 <chem>CCN(CC)CCN(C)Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2c3c(s2)C4CCCCC4C(=O)Nc5cccc(F)c5</chem>
化合物613	 <chem>CCN(CC)CCN(C)Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2c3c(s2)C4CCCCC4C(=O)Nc5cc(C(F)(F)F)c(Cl)cc5</chem>
化合物614	 <chem>CCN(CC)CCN(C)Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2c3c(s2)C4CCCCC4C(=O)Nc5ccc(OC)cc5</chem>

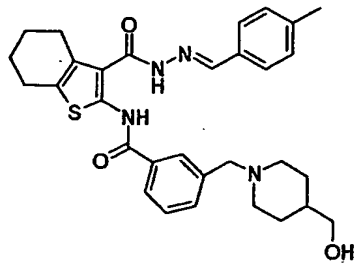
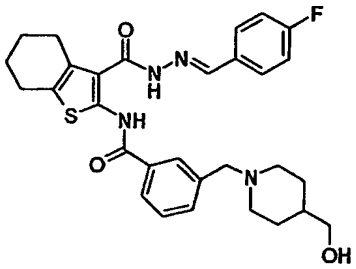
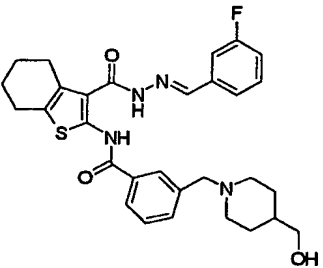
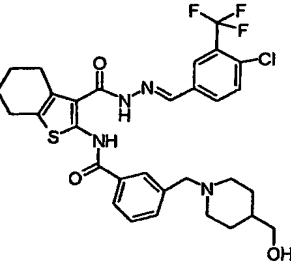
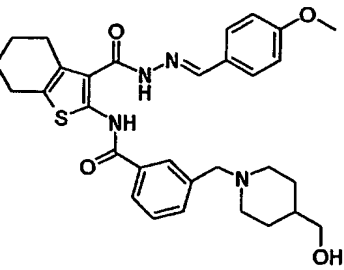
[illegible]

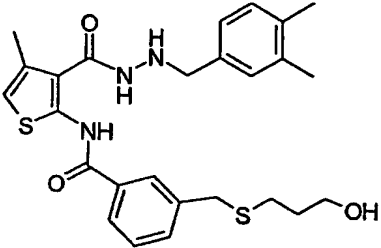
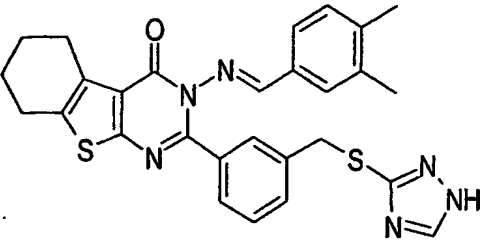
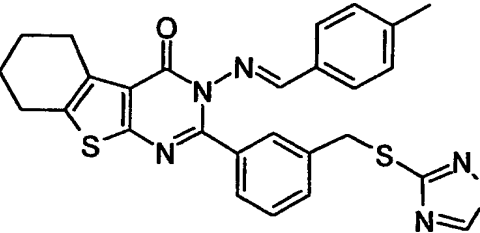
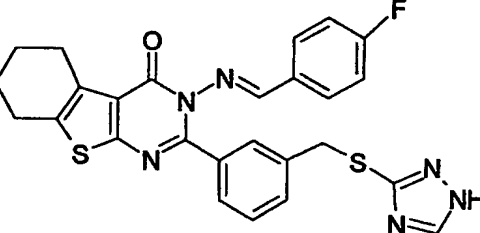
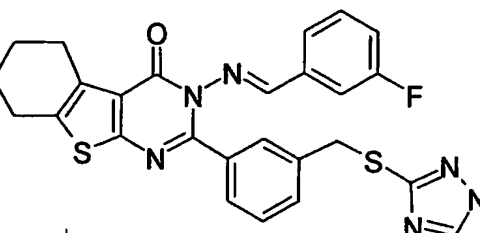
化合物620	
化合物621	
化合物622	
化合物623	
化合物624	

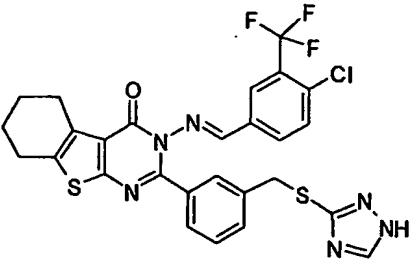
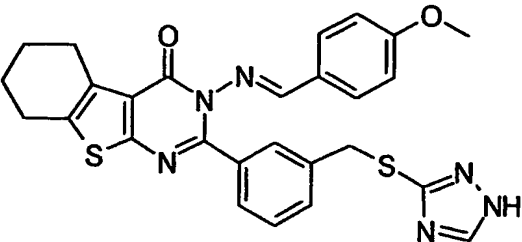
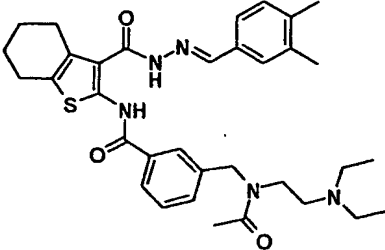
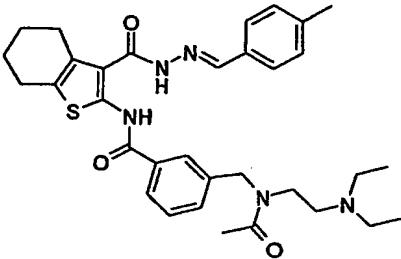
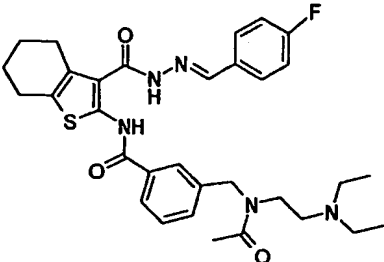
化合物625	
化合物626	
化合物627	
化合物628	
化合物629	

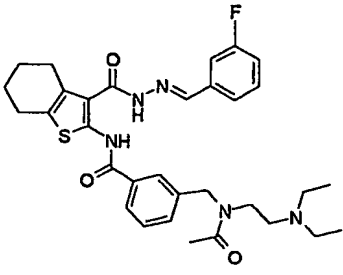
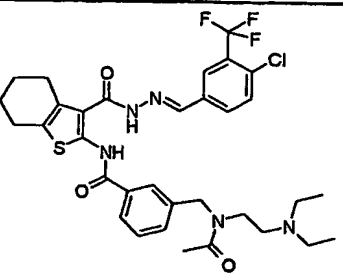
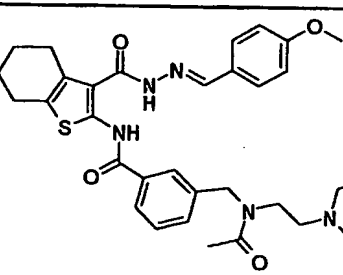
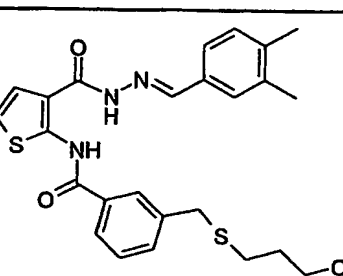
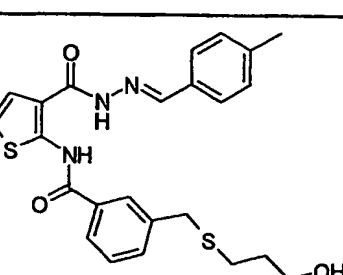
化合物630	
化合物631	
化合物632	
化合物633	
化合物634	

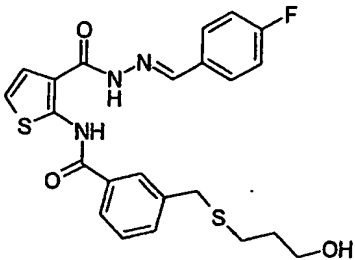
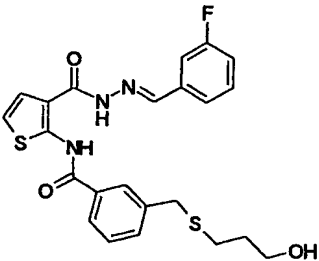
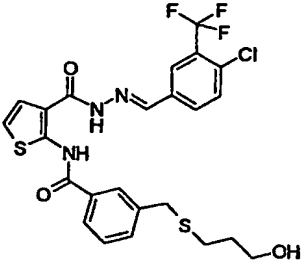
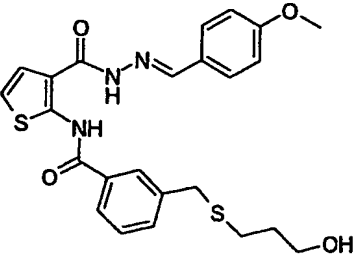
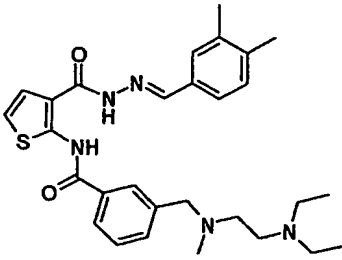
化合物635	
化合物636	
化合物637	
化合物638	
化合物639	

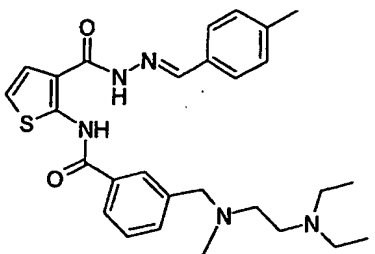
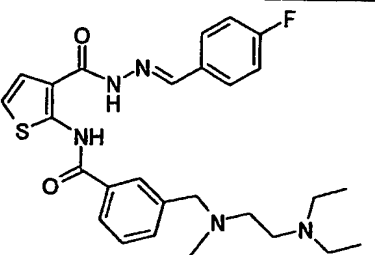
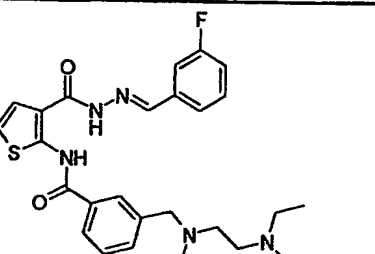
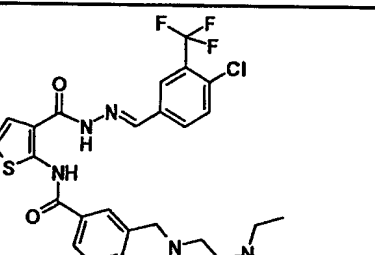
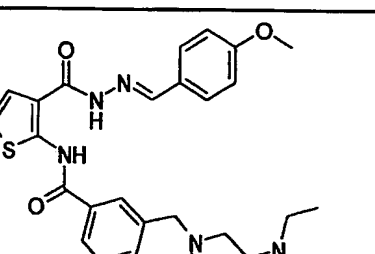
化合物640	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)/N=N/C2=C3C(=C(C=C2)SC3=CC4CCCCC4)NC(=O)C5=CC=C(C=C5)CN6CCOCC6</chem>
化合物641	 <chem>Fc1ccc(cc1)/N=N/C2=C3C(=C(C=C2)SC3=CC4CCCCC4)NC(=O)C5=CC=C(C=C5)CN6CCOCC6</chem>
化合物642	 <chem>Fc1cccc(c1)/N=N/C2=C3C(=C(C=C2)SC3=CC4CCCCC4)NC(=O)C5=CC=C(C=C5)CN6CCOCC6</chem>
化合物643	 <chem>Clc1cc(cc(c1)C(F)(F)F)/N=N/C2=C3C(=C(C=C2)SC3=CC4CCCCC4)NC(=O)C5=CC=C(C=C5)CN6CCOCC6</chem>
化合物644	 <chem>COc1ccc(cc1)/N=N/C2=C3C(=C(C=C2)SC3=CC4CCCCC4)NC(=O)C5=CC=C(C=C5)CN6CCOCC6</chem>

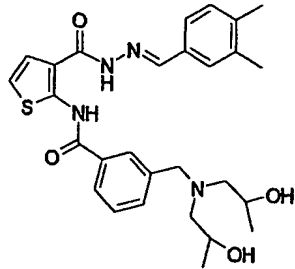
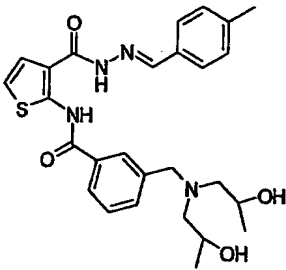
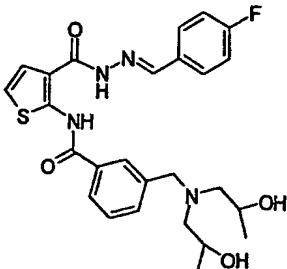
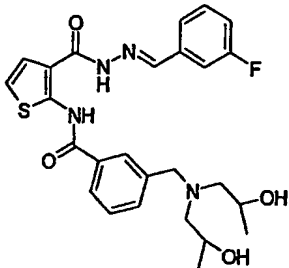
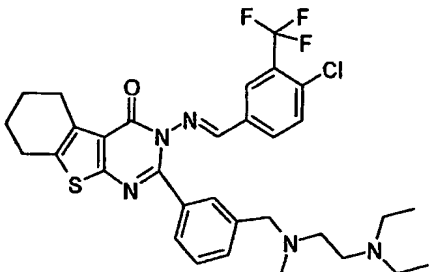
化合物645	 <chem>Cc1cc(C)ccc1NC(=O)c2sc(C)cc2NC(=O)c3ccccc3SCCO</chem>
化合物646	 <chem>Cc1cc(C)ccc1N=Nc2nc3c(s2)C4CCCCC4n3Cc5ccc(cc5)SC6=NNC=N6</chem>
化合物647	 <chem>Cc1ccc(cc1)N=Nc2nc3c(s2)C4CCCCC4n3Cc5ccc(cc5)SC6=NNC=N6</chem>
化合物648	 <chem>Fc1ccc(cc1)N=Nc2nc3c(s2)C4CCCCC4n3Cc5ccc(cc5)SC6=NNC=N6</chem>
化合物649	 <chem>Fc1cccc(c1)N=Nc2nc3c(s2)C4CCCCC4n3Cc5ccc(cc5)SC6=NNC=N6</chem>

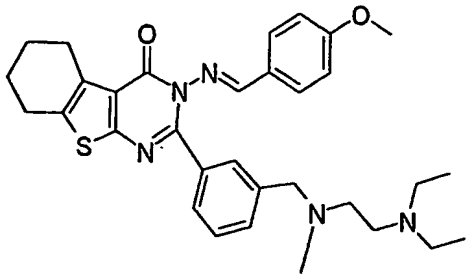
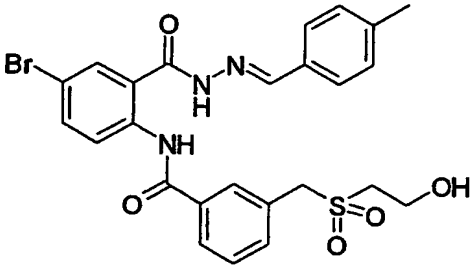
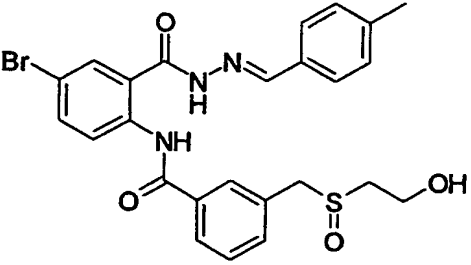
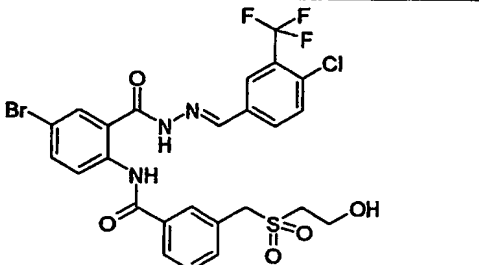
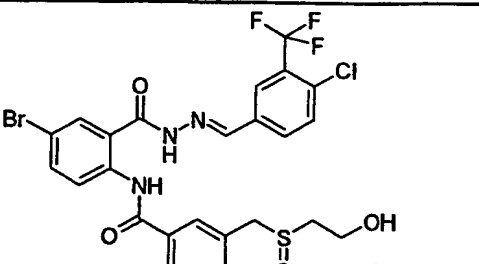
化合物650	
化合物651	
化合物652	
化合物653	
化合物654	

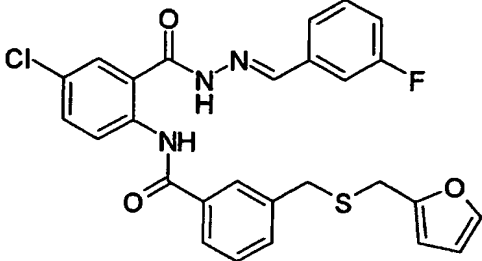
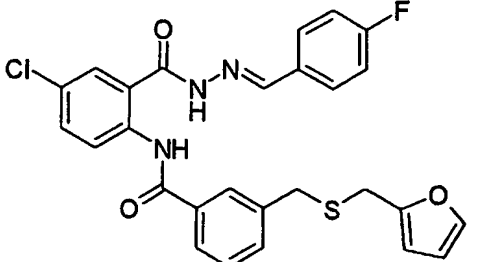
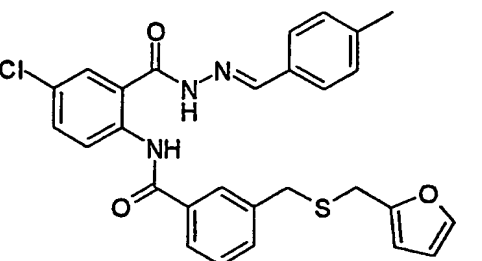
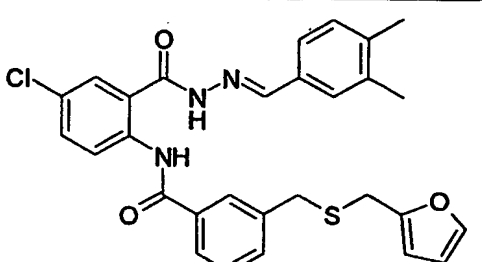
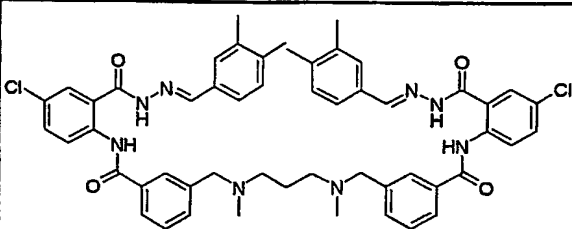
化合物655	
化合物656	
化合物657	
化合物658	
化合物659	

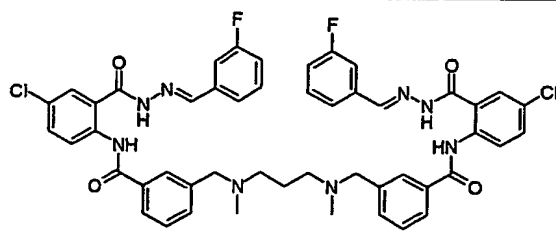
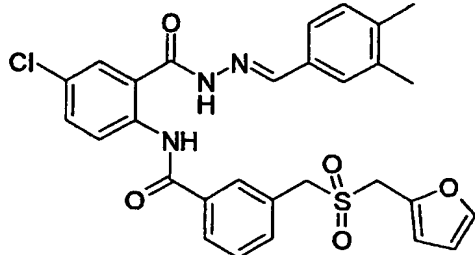
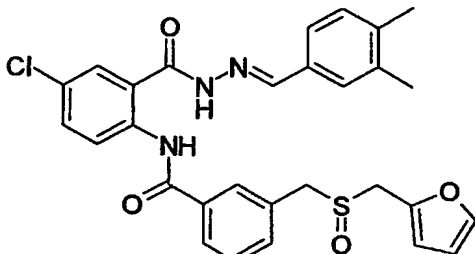
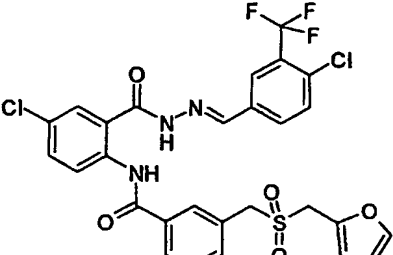
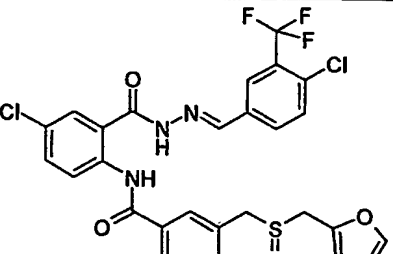
化合物660	 <chem>OCCSCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3c(s2)C(=O)Nc4ccc(F)cc4</chem>
化合物661	 <chem>OCCSCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3c(s2)C(=O)Nc4ccc(F)cc4</chem>
化合物662	 <chem>OCCSCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3c(s2)C(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)c(Cl)c4</chem>
化合物663	 <chem>OCCSCc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3c(s2)C(=O)Nc4ccc(OC)cc4</chem>
化合物664	 <chem>CCN(CC)Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc3c(s2)C(=O)Nc4cc(C)c(C)cc4</chem>

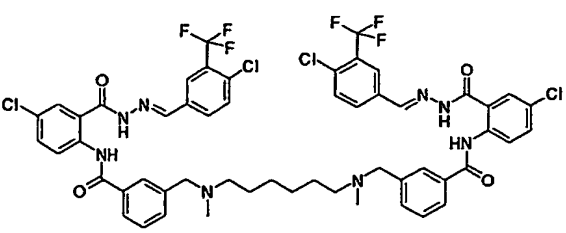
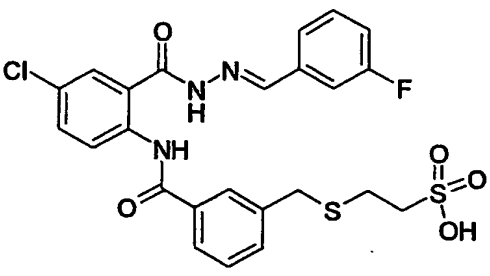
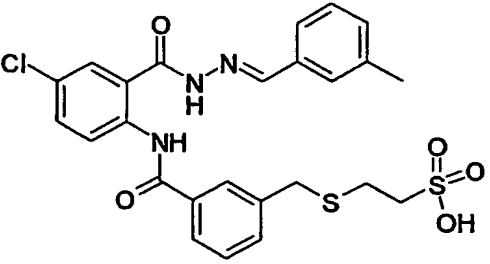
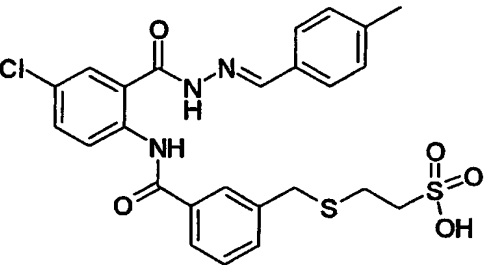
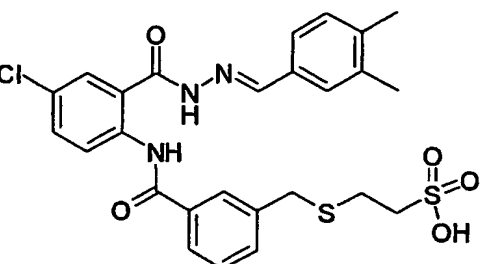
化合物665	
化合物666	
化合物667	
化合物668	
化合物669	

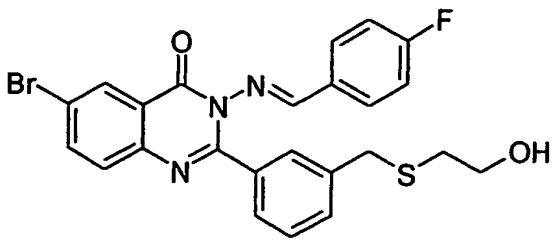
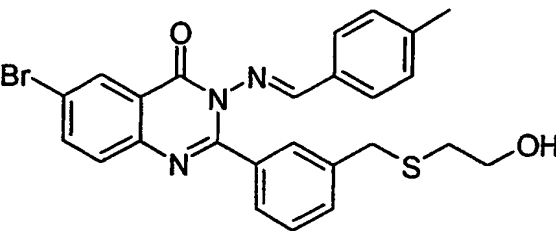
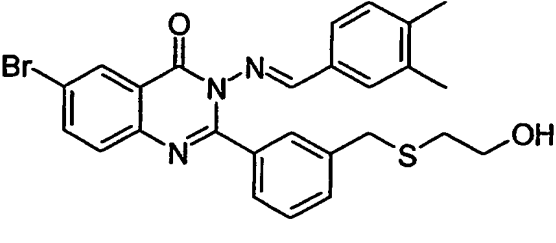
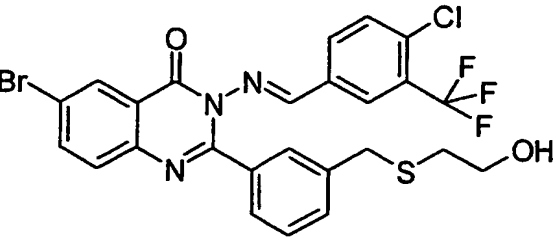
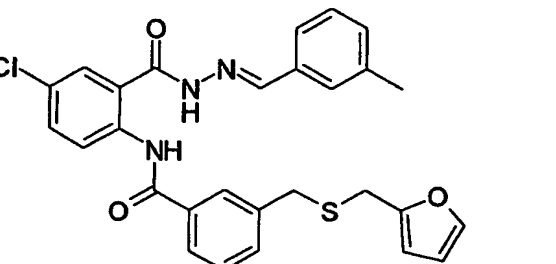
化合物670	
化合物671	
化合物672	
化合物673	
化合物674	

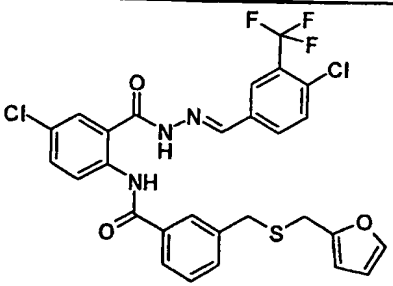
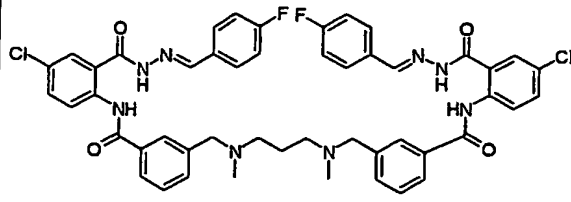
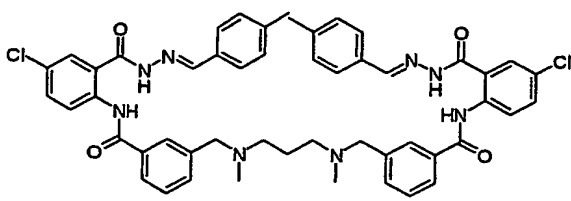
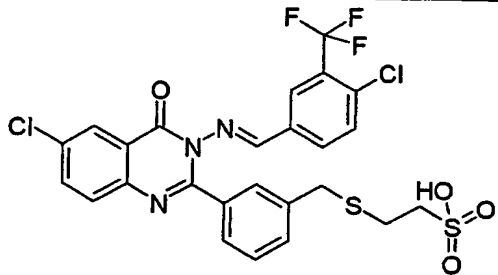
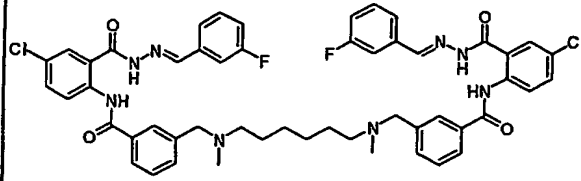
化合物675	
化合物676	
化合物677	
化合物678	
化合物679	

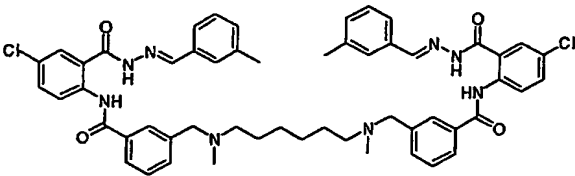
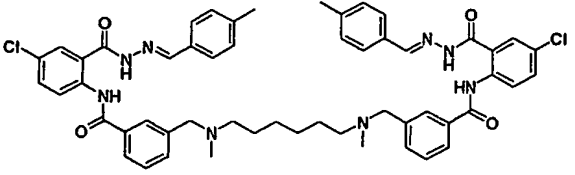
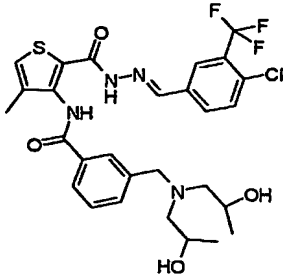
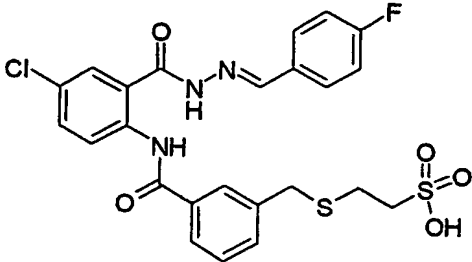
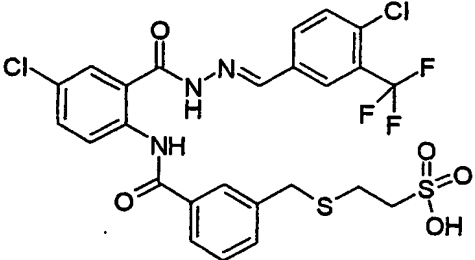
化合物680	
化合物681	
化合物682	
化合物683	
化合物684	

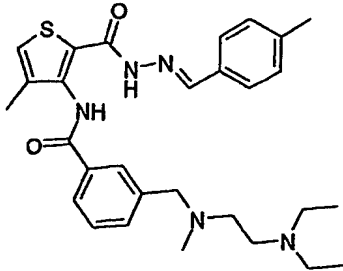
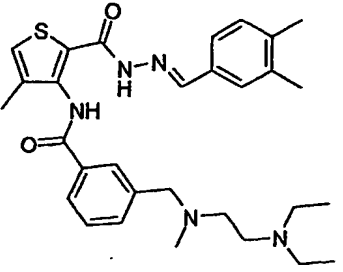
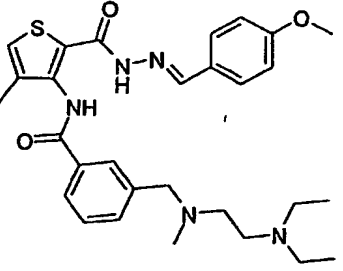
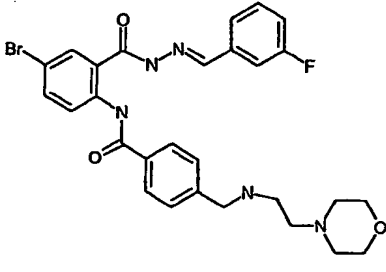
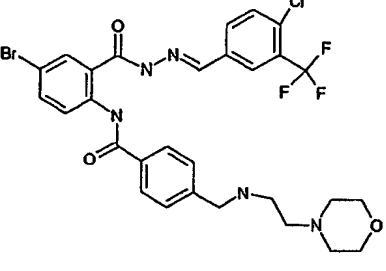
化合物685	
化合物686	
化合物687	
化合物688	
化合物689	

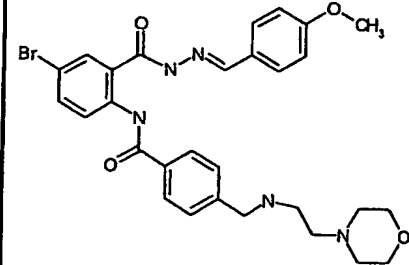
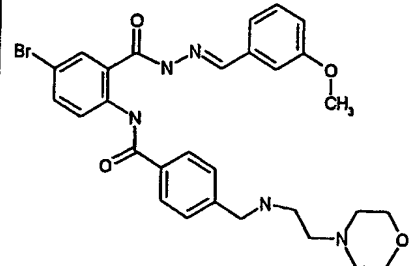
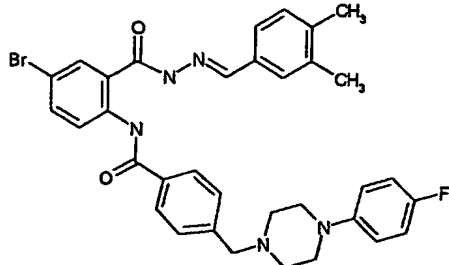
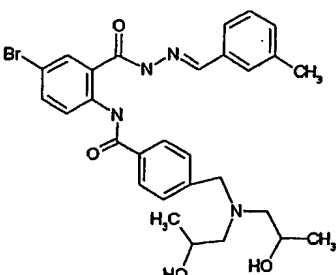
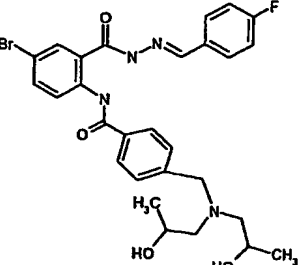
化合物690	
化合物691	
化合物692	
化合物693	
化合物694	

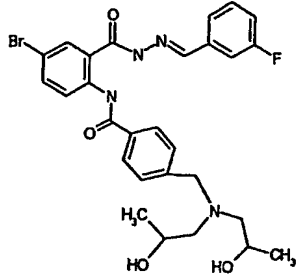
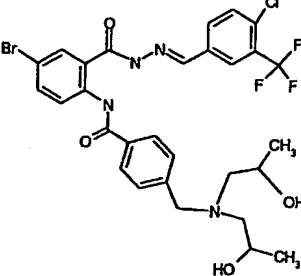
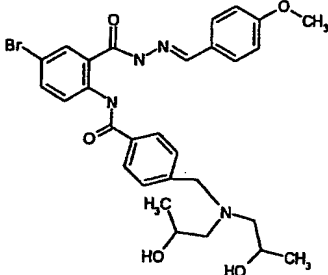
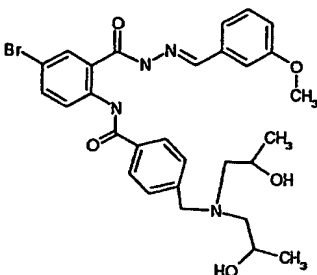
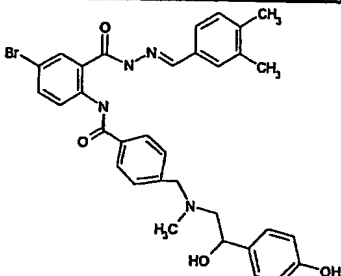
化合物695	
化合物696	
化合物697	
化合物698	
化合物699	

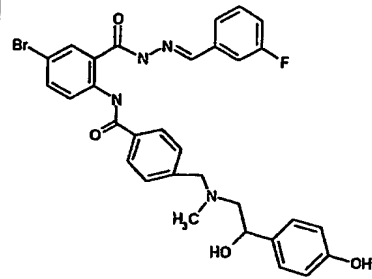
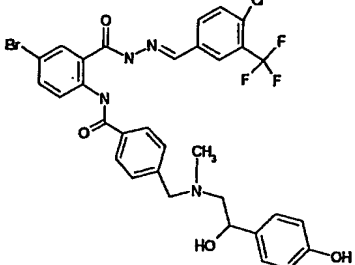
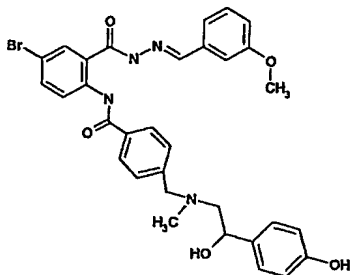
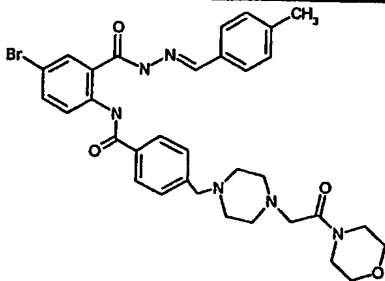
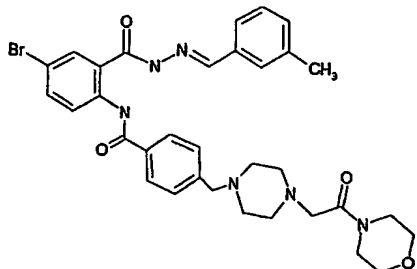
化合物700	
化合物701	
化合物702	
化合物703	
化合物704	

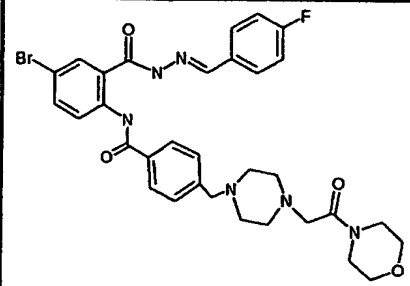
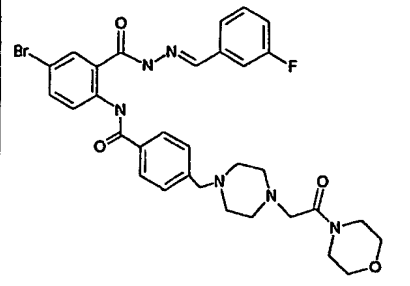
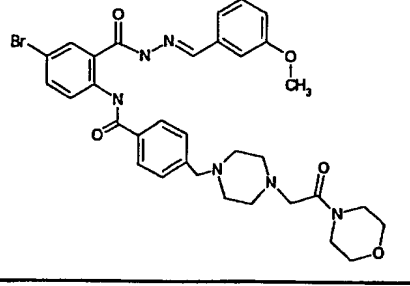
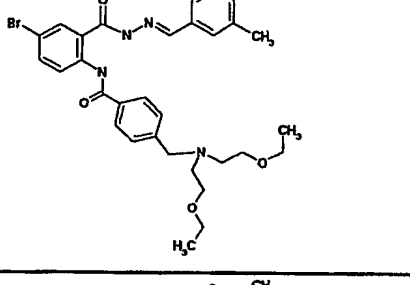
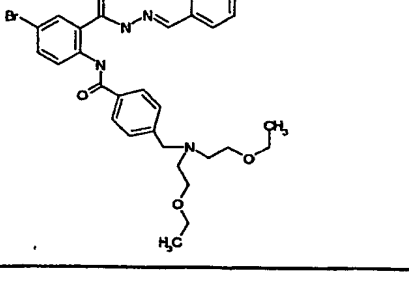
化合物705	
化合物706	
化合物707	
化合物708	
化合物709	

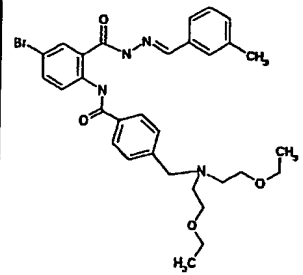
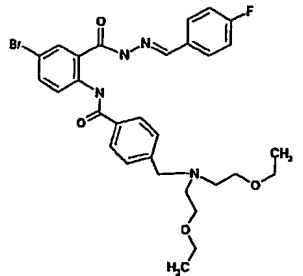
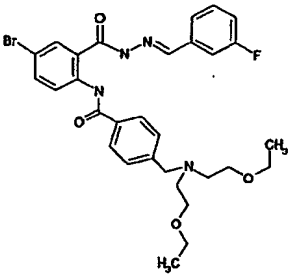
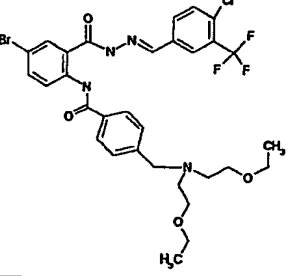
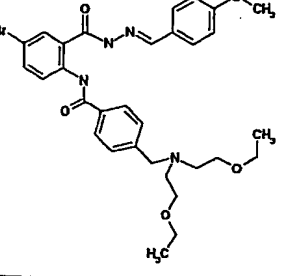
化合物710	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)NN=C2C=CC(=CC=C2)C(=O)Nc3cc(C)cc(C(=O)Nc4ccc(cc4)CN(CC)CCN(CC)CC)c5ccccc53</chem>
化合物711	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)NN=C2C=CC(=CC=C2)C(=O)Nc3cc(C)cc(C(=O)Nc4ccc(cc4)CN(CC)CCN(CC)CC)c5ccccc53</chem>
化合物712	 <chem>COc1ccc(cc1)/N=N/C(=O)Nc2cc(C)cc(C(=O)Nc3ccc(cc3)CN(CC)CCN(CC)CC)c4ccccc42</chem>
化合物713	 <chem>BrC1=CC=C(C=C1)C(=O)NN=C2C=CC(=CC=C2)C(=O)Nc3ccc(cc3)CN(CC)CCN4CCOCC4</chem>
化合物714	 <chem>BrC1=CC=C(C=C1)C(=O)NN=C2C=CC(=CC=C2)C(=O)Nc3ccc(cc3)CN(CC)CCN4CCOCC4</chem>

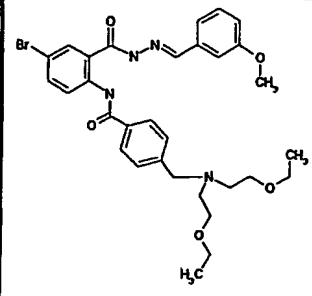
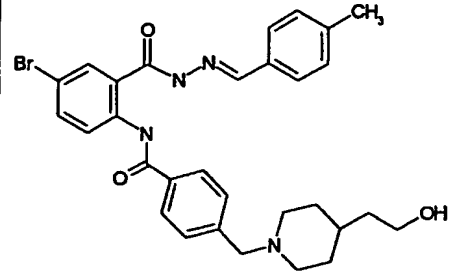
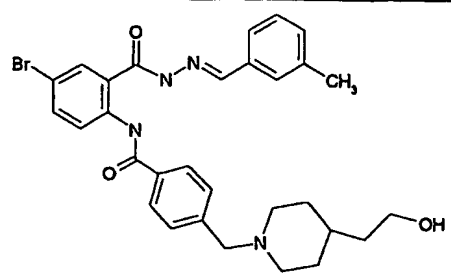
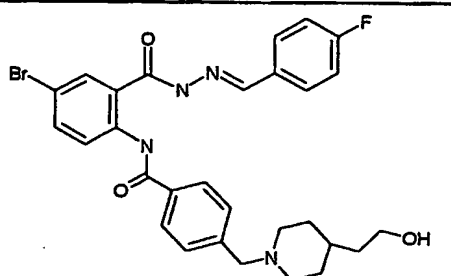
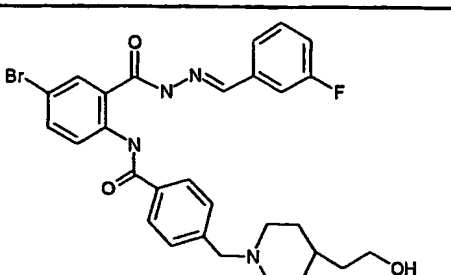
化合物715	
化合物716	
化合物717	
化合物718	
化合物719	

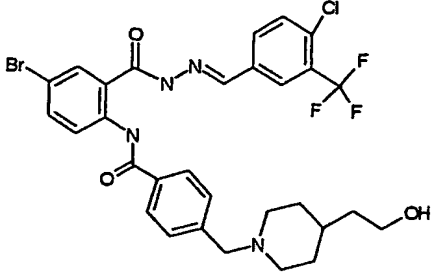
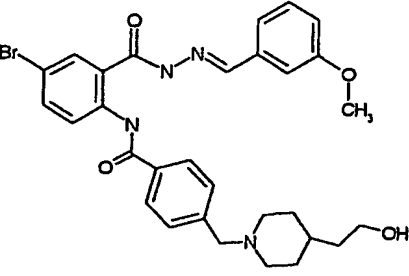
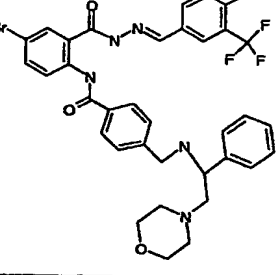
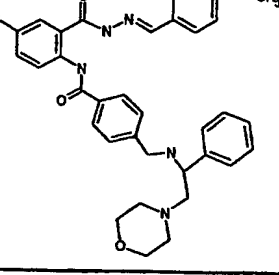
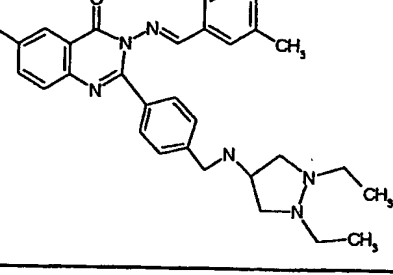
化合物720	
化合物721	
化合物722	
化合物723	
化合物724	

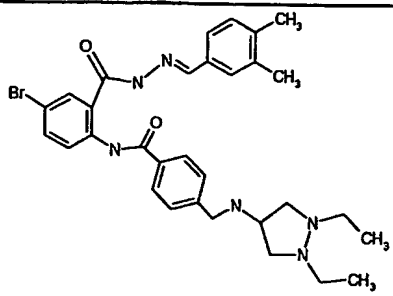
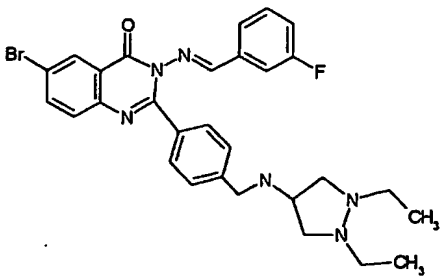
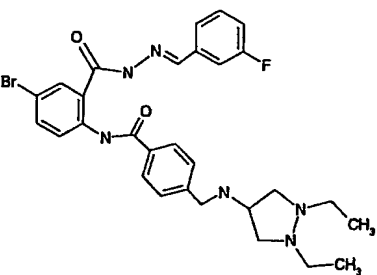
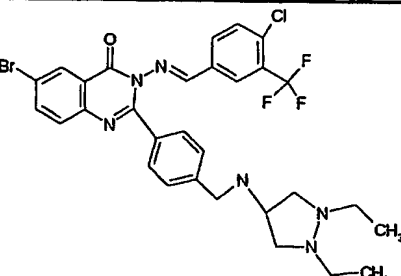
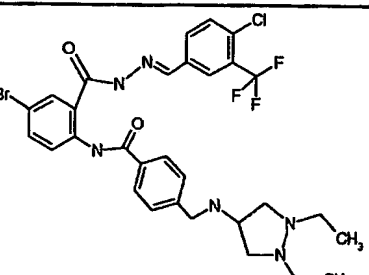
化合物725	
化合物726	
化合物727	
化合物728	
化合物729	

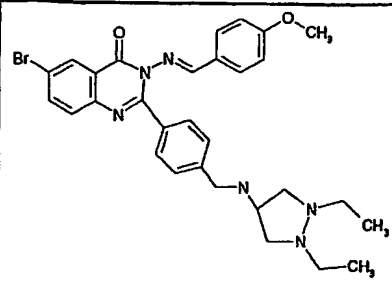
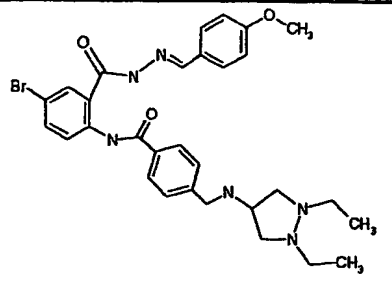
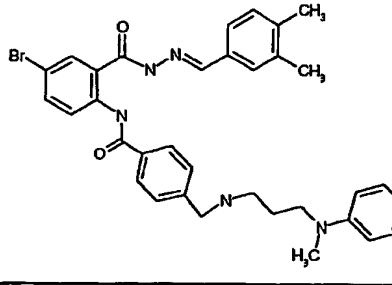
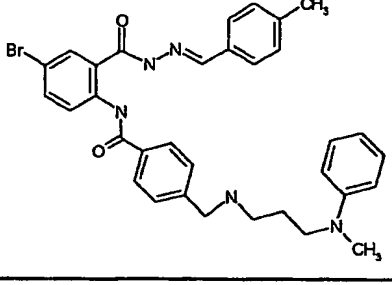
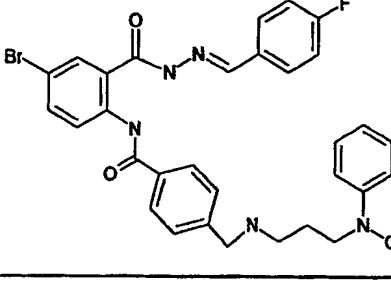
化合物730	
化合物731	
化合物732	
化合物733	
化合物734	

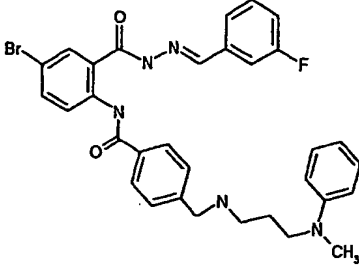
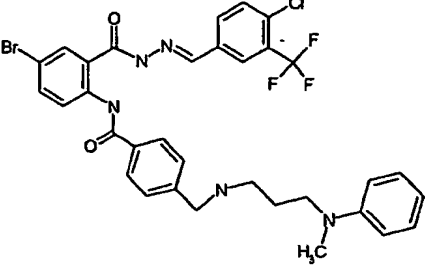
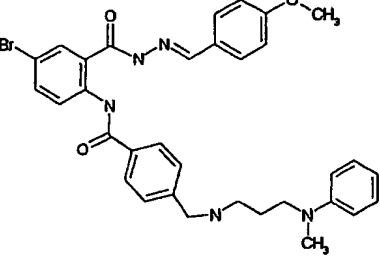
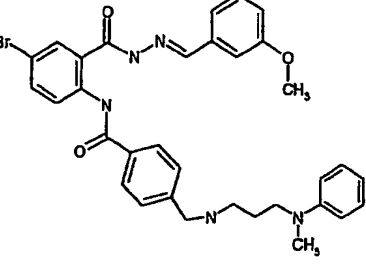
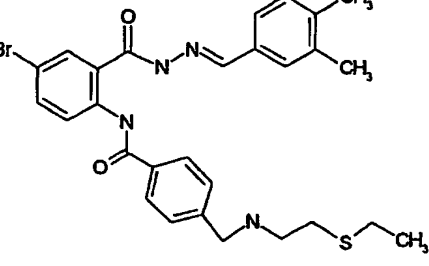
化合物735	
化合物736	
化合物737	
化合物738	
化合物739	

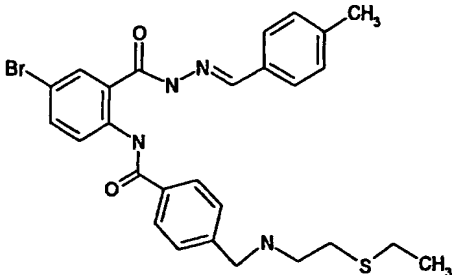
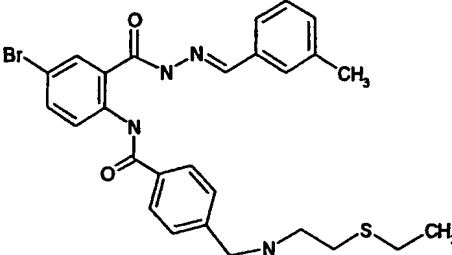
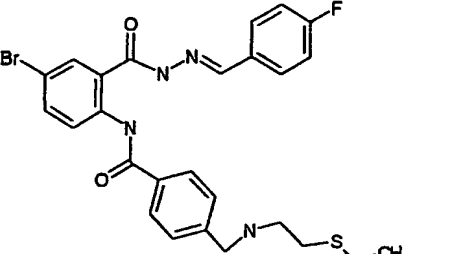
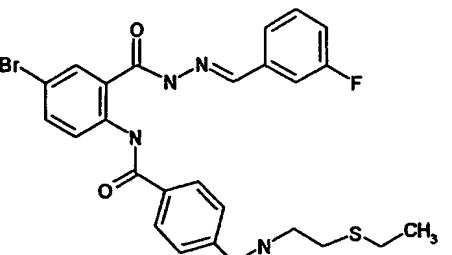
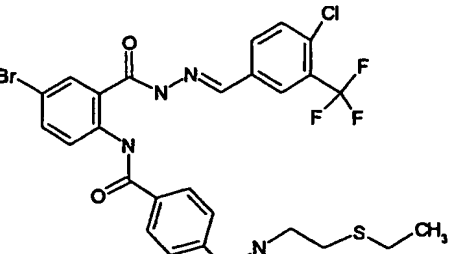
化合物740	
化合物741	
化合物742	
化合物743	
化合物744	

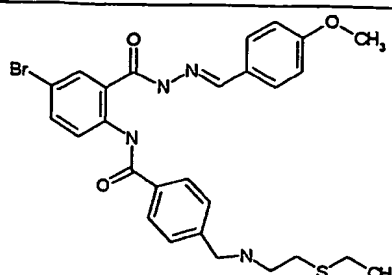
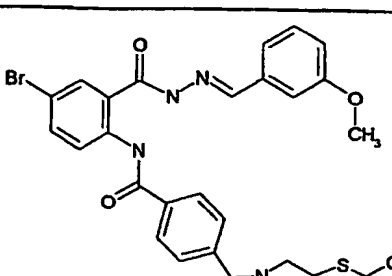
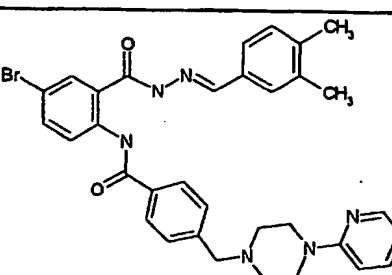
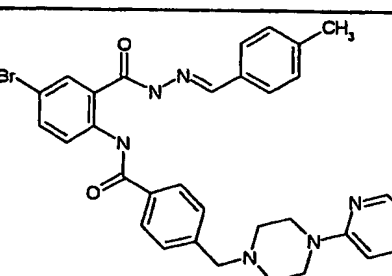
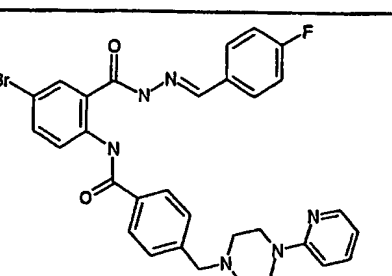
化合物745	
化合物746	
化合物747	
化合物748	
化合物749	

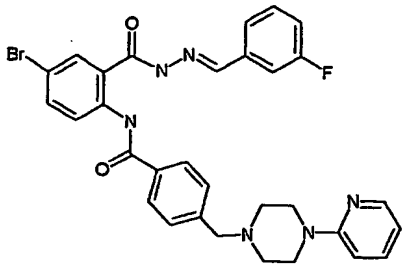
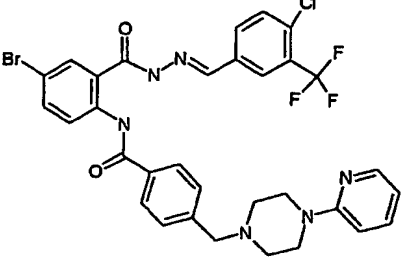
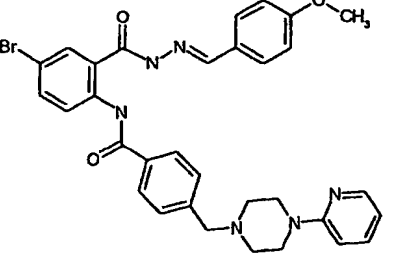
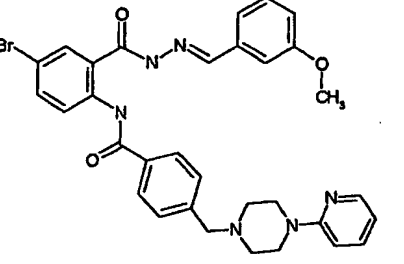
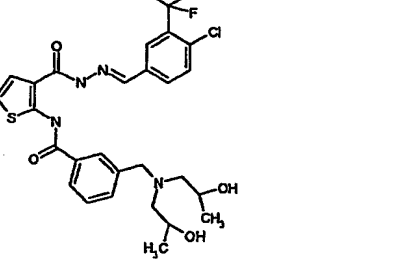
化合物750	
化合物751	
化合物752	
化合物753	
化合物754	

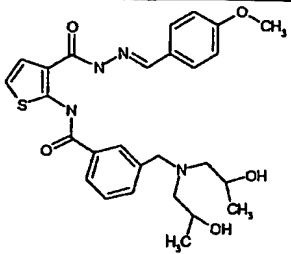
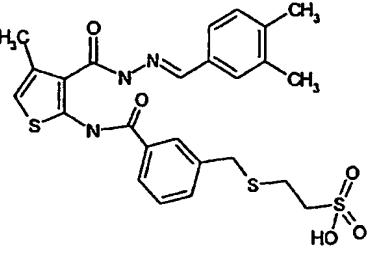
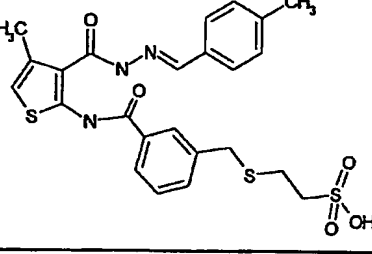
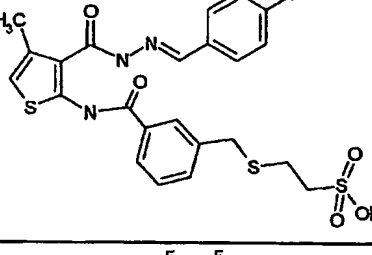
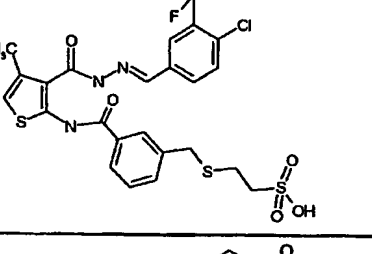
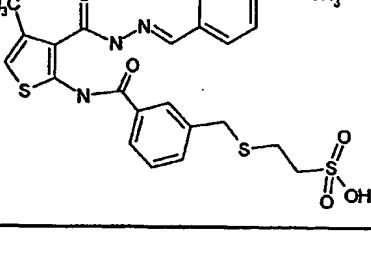
化合物755	
化合物756	
化合物757	
化合物758	
化合物759	

化合物760	
化合物761	
化合物762	
化合物763	
化合物764	

化合物765	
化合物766	
化合物767	
化合物768	
化合物769	

化合物770	
化合物771	
化合物772	
化合物773	
化合物774	

化合物775	
化合物776	
化合物777	
化合物778	
化合物779	

化合物780	
化合物781	
化合物782	
化合物783	
化合物784	
化合物785	

【0928】

薬理試験例 1: NaPi-2b を発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性のリン酸取り込み実験

Hilfiker H. et. al., Pro Natl Acad Sci USA, 95(24):14564-14569, 1988 に示されたマウス NaPi-2b と、Magagnin S. et. al., Proc Natl Aca Sci USA, 90(13):5979-5983, 1993 に示されたヒトおよびラット NaPi-2a の配列より縮重プライマー (degenerate primer) を作製し、ラット小腸より RNA を抽出し (ISOGEN 日本国 ニッポンジーン社製使用)、cDNA 合成キット (米国 STRATAGENE 社製) にて作製した cDNA ライブラリーを鋳型に用いて、PCR 法にて 400 bp の遺伝子断片を取得した。その後、得られた遺伝子断片をプローブに前記ラット小腸 cDNA ライブラリーをスクリーニングし、ラット NaPi-2b の全長遺伝子配列をクローニングした。クローニングしたラット NaPi-2b cDNA より、cRNA 合成キット (米国 Ambion 社製) にて cRNA を合成した。合成 cRNA はアフリカツメガエル卵母細胞 (日本国 コパセティック社より入手) に微量液体注入装置 (米国 Drummond 社製) にて注入し、2 日間培養することによりラット NaPi-2b を発現させた。その後、同アフリカツメガエル卵母細胞を用いて誘導体群のリン取り込み阻害活性を ^{32}P 放射性リン (日本国 第一化学社製) を用いて測定したところ、同化合物は表 3 に示すような IC₅₀ 値をもって阻害活性を示した。IC₅₀ 値の算出に関しては、化合物の 5 つの濃度より得られた阻害活性値より最少二乗法を用いた近似式で阻害曲線を求め、最大阻害活性の 50 % を示す化合物の濃度を求めた。また、同様の阻害曲線より、300 μM における阻害活性を阻害率 (%) で表 4 に示した。

【0929】

【表 3】

化合物番号	IC50(μ M)
化合物1	9.11
化合物3	7.15
化合物4	79.93
化合物5	3.31
化合物6	5.38
化合物7	7.15
化合物8	1.72
化合物9	4.26
化合物10	26.12
化合物11	8.21
化合物12	4.51
化合物13	9.22
化合物14	12.10
化合物15	1.41
化合物16	2.30
化合物17	3.59
化合物18	4.03
化合物19	8.16
化合物20	2.83
化合物21	21.53
化合物22	26.67
化合物23	9.88
化合物24	20.92
化合物25	23.91
化合物26	25.37
化合物27	3.63
化合物28	5.12
化合物29	0.55
化合物30	7.86

化合物31	0.58
化合物32	1.95
化合物33	15.02
化合物34	1.50
化合物35	3.23
化合物36	4.04
化合物37	13.47
化合物38	5.64
化合物39	9.24
化合物40	2.03
化合物41	2.43
化合物42	8.21
化合物43	20.66
化合物44	4.71
化合物45	26.14
化合物46	7.41
化合物47	4.38
化合物48	2.07
化合物49	3.37
化合物50	19.48
化合物51	4.60
化合物52	10.39
化合物53	4.05
化合物54	6.45
化合物55	0.86
化合物56	0.89
化合物57	1.02
化合物58	7.67
化合物59	1.22
化合物60	1.58

化合物61	0.31
化合物62	0.90
化合物63	5.97
化合物64	3.77
化合物65	1.29
化合物66	0.89
化合物67	0.65
化合物68	0.36
化合物69	3.93
化合物70	9.51
化合物71	12.33
化合物72	10.41
化合物73	1.75
化合物74	2.15
化合物75	12.77
化合物76	13.17
化合物77	3.01
化合物78	7.17
化合物79	2.87
化合物80	10.87
化合物81	5.65
化合物82	6.03
化合物83	2.98
化合物84	8.42
化合物85	2.00
化合物86	11.4
化合物87	0.29
化合物88	0.22
化合物89	1.11
化合物90	3.42

化合物91	0.22
化合物92	0.26
化合物93	10.98
化合物94	5.63
化合物95	1.27
化合物96	5.94
化合物97	0.51
化合物98	0.62
化合物99	3.03
化合物100	0.64
化合物101	0.75
化合物102	5.58
化合物103	5.73
化合物104	11.34
化合物105	7.29
化合物106	5.11
化合物107	1.08
化合物108	3.83
化合物109	6.18
化合物110	7.70
化合物111	9.12
化合物112	41.98
化合物113	17.91
化合物114	2.55
化合物115	5.48
化合物116	7.01
化合物117	0.58
化合物118	6.07
化合物119	0.74
化合物120	2.55

化合物121	4.06
化合物122	<3.00
化合物123	3.77
化合物124	3.15
化合物125	136.43
化合物126	6.43
化合物127	11.59
化合物128	11.61
化合物129	13.70
化合物130	11.42
化合物132	0.75
化合物133	0.88
化合物134	7.82
化合物135	3.74
化合物136	4.52
化合物137	3.00
化合物138	4.47
化合物139	55.50
化合物140	74.24
化合物141	5.78
化合物142	9.20
化合物143	5.88
化合物144	5.02
化合物145	3.82
化合物146	1.99
化合物147	7.68
化合物148	15.63
化合物149	5.51
化合物150	1.09

化合物151	3.07
化合物152	1.48
化合物153	3.50
化合物154	2.37
化合物155	0.32
化合物156	0.46
化合物157	7.19
化合物158	3.28
化合物159	4.35
化合物160	0.93
化合物161	0.96
化合物162	3.11
化合物163	1.60
化合物164	4.76
化合物165	2.43
化合物166	27.85
化合物167	30.20
化合物168	4.84
化合物169	4.24
化合物170	5.34
化合物171	5.12
化合物172	2.74
化合物173	7.40
化合物174	12.54
化合物175	3.57
化合物176	4.10
化合物177	26.01
化合物178	7.54
化合物179	18.69
化合物180	<3.00

化合物181	3.16
化合物182	10.24
化合物183	<3.00
化合物184	4.01
化合物185	2.02
化合物186	10.1
化合物187	7.87
化合物188	19.43
化合物189	1.47
化合物190	20.32
化合物191	12.12
化合物192	23.09
化合物193	4.21
化合物194	7.36
化合物195	0.98
化合物196	0.61
化合物197	4.87
化合物198	2.71
化合物199	1.82
化合物200	0.39
化合物201	11.10
化合物202	3.14
化合物203	<3.00
化合物204	<3.00
化合物205	<3.00
化合物206	<3.00
化合物207	<1.00
化合物208	<0.30
化合物209	<1.00
化合物210	34.96

化合物211	69.07
化合物212	71.27
化合物213	16.64
化合物214	3.95
化合物215	<3.00
化合物216	21.82
化合物217	11.21
化合物218	4.05
化合物219	9.07
化合物220	9.42
化合物221	9.51
化合物222	8.86
化合物223	11.30
化合物224	19.99
化合物225	60.98
化合物226	1.69
化合物227	7.40
化合物228	22.48
化合物229	6.32
化合物252	1.49
化合物253	3.47
化合物255	3.54
化合物256	<10.00
化合物257	<3.00
化合物258	<3.00
化合物259	<3.00
化合物260	<3.00

化合物261	<3.00
化合物262	1.10
化合物263	<1.00
化合物264	<1.00
化合物265	<1.00
化合物266	<1.00
化合物267	0.43
化合物268	1.02
化合物269	2.19
化合物270	5.04
化合物271	0.21
化合物272	0.47
化合物273	0.15
化合物274	1.04
化合物275	1.73
化合物276	6.20
化合物277	1.60
化合物278	0.16
化合物279	2.31
化合物280	0.78
化合物281	4.60
化合物282	6.71
化合物283	22.44
化合物284	26.94
化合物285	0.90
化合物286	0.57
化合物287	0.11
化合物288	1.31
化合物289	2.89
化合物290	3.25

化合物291	1.16
化合物292	3.50
化合物293	5.59
化合物294	7.80
化合物295	7.58
化合物296	1.45
化合物297	0.96
化合物298	9.22
化合物299	3.91
化合物300	1.92
化合物301	15.17
化合物302	1.12
化合物303	1.13
化合物304	1.23
化合物305	2.47
化合物306	2.13
化合物307	41.17
化合物308	2.76
化合物309	15.12
化合物310	7.82
化合物311	7.78
化合物312	3.31
化合物313	1.24
化合物314	3.39
化合物315	9.02
化合物316	4.71
化合物317	5.02
化合物318	2.49
化合物319	9.76
化合物320	4.09

化合物321	2.66
化合物322	5.93
化合物323	4.69
化合物324	4.43
化合物325	2.56
化合物326	2.10
化合物327	5.12
化合物328	1.15
化合物329	5.63
化合物330	10.69
化合物331	15.76
化合物332	2.87
化合物333	17.18
化合物334	7.69
化合物335	5.86
化合物336	16.63
化合物337	1.39
化合物338	18.97
化合物339	12.77
化合物340	8.41
化合物341	<3.00
化合物342	32.60
化合物343	124.10
化合物344	30.99
化合物345	129.95
化合物346	4.46
化合物347	4.91
化合物348	16.59
化合物349	8.78
化合物350	25.32

化合物351	8.96
化合物352	13.00
化合物353	8.85
化合物354	1.54
化合物356	0.17
化合物358	54.07
化合物359	7.10
化合物360	0.63
化合物361	<1.00
化合物362	<1.00
化合物363	<1.00
化合物364	<1.00
化合物367	6.88
化合物368	1.37
化合物369	1.45
化合物370	1.86
化合物371	2.54
化合物372	0.80
化合物373	1.68
化合物374	9.25
化合物375	24.71
化合物376	21.00
化合物377	9.65
化合物378	4.35
化合物379	0.97
化合物380	0.35

化合物381	1.00
化合物382	1.04
化合物383	1.98
化合物384	0.25
化合物385	0.31
化合物386	<3.00
化合物387	6.45
化合物388	19.67
化合物389	1.09
化合物390	0.45
化合物391	1.02
化合物392	1.42
化合物393	0.52
化合物394	0.95
化合物395	8.55
化合物396	8.19
化合物397	9.25
化合物398	<0.30
化合物399	3.67
化合物400	<0.30
化合物401	6.13
化合物402	14.12
化合物403	26.73
化合物404	2.18
化合物405	1.90
化合物406	0.88
化合物407	0.57
化合物408	0.69
化合物409	2.52
化合物410	4.05

化合物411	10.08
化合物412	7.96
化合物413	<3.00
化合物414	<3.00
化合物415	<3.00
化合物416	3.25
化合物417	<3.00
化合物418	9.38
化合物419	9.20
化合物420	27.14
化合物421	29.56
化合物422	1.15
化合物423	<3.00
化合物424	1.79
化合物425	<3.00
化合物426	1.89
化合物427	<3.00
化合物428	1.82
化合物429	5.88
化合物430	4.53
化合物431	5.57
化合物432	22.22
化合物433	14.34
化合物434	7.78
化合物435	7.65
化合物436	8.36
化合物437	<3.00
化合物438	26.27
化合物439	28.74
化合物440	32.35

化合物441	40.14
化合物442	3.15
化合物443	11.05
化合物444	<3.00
化合物445	10.33
化合物446	1.54
化合物447	2.16
化合物448	9.41
化合物449	21.73
化合物450	16.94
化合物451	37.84
化合物452	<3.00
化合物453	<3.00
化合物454	<3.00
化合物455	<3.00
化合物456	<3.00
化合物457	<3.00
化合物458	<3.00
化合物459	<3.00
化合物460	<3.00
化合物461	3.59
化合物462	<3.00
化合物463	4.44
化合物464	5.00
化合物465	7.43
化合物466	<3.00
化合物467	7.94
化合物468	22.45
化合物469	33.16
化合物470	23.54

化合物472	<3.00
化合物473	<3.00
化合物474	<3.00
化合物475	<3.00
化合物476	<3.00
化合物477	<3.00
化合物478	<3.00
化合物479	<3.00
化合物480	<3.00
化合物481	12.10
化合物482	<3.00
化合物483	<3.00
化合物484	<3.00
化合物485	<3.00
化合物486	<3.00
化合物487	<3.00
化合物488	<3.00
化合物489	<3.00
化合物490	<3.00
化合物491	<3.00
化合物492	<3.00
化合物493	<3.00
化合物494	2.07
化合物495	0.35
化合物496	0.64
化合物497	0.51
化合物498	0.60
化合物499	0.98
化合物500	0.35

化合物501	23.13
化合物502	15.68
化合物503	10.35
化合物504	18.93
化合物505	1.21
化合物506	19.5
化合物507	1.86
化合物508	0.48
化合物509	13.59
化合物510	1.48
化合物511	2.16
化合物512	28.30
化合物513	15.96
化合物514	2.15
化合物515	1.90
化合物516	2.13
化合物517	1.71
化合物518	1.52
化合物519	1.72
化合物521	1.24
化合物522	1.09
化合物551	0.47
化合物552	2.63
化合物553	2.80
化合物554	1.46
化合物555	<3.00
化合物556	<3.00
化合物557	<0.30
化合物558	1.07
化合物559	1.26
化合物560	1.09

化合物561	0.31
化合物562	<1.00
化合物563	<1.00
化合物564	11.57
化合物565	12.98
化合物566	14.58
化合物567	<1.00
化合物568	4.32
化合物569	<3.00
化合物570	6.04
化合物571	5.27
化合物572	4.12
化合物573	1.75
化合物574	6.93
化合物575	<3.00
化合物576	<3.00
化合物577	<3.00
化合物578	<3.00
化合物579	<3.00
化合物580	<3.00
化合物581	<3.00
化合物582	<3.00
化合物583	<3.00
化合物584	<3.00
化合物585	<3.00
化合物586	<3.00
化合物587	<3.00
化合物588	9.33
化合物589	<3.00
化合物590	6.18

化合物591	1.01
化合物592	11.94
化合物593	<3.00
化合物594	3.60
化合物595	3.87
化合物596	5.47
化合物597	1.47
化合物598	53.04
化合物599	<3.00
化合物600	3.84
化合物601	<3.00
化合物602	3.98
化合物603	<3.00
化合物604	9.23
化合物605	0.95
化合物606	1.01
化合物607	0.43
化合物608	<0.30
化合物609	<0.30
化合物610	1.82
化合物611	2.16
化合物612	2.34
化合物613	1.41
化合物614	3.29
化合物615	2.08
化合物616	13.86
化合物617	3.68
化合物618	4.25
化合物619	<3.00
化合物620	3.58

化合物621	<3.00
化合物622	<3.00
化合物623	<3.00
化合物624	<3.00
化合物625	<3.00
化合物626	<3.00
化合物627	<1.00
化合物628	1.29
化合物629	3.01
化合物630	<1.00
化合物631	<1.00
化合物632	<1.00
化合物633	1.19
化合物634	1.74
化合物635	1.56
化合物636	3.89
化合物637	<1.00
化合物638	3.15
化合物639	1.84
化合物640	1.61
化合物641	2.92
化合物642	2.14
化合物643	3.68
化合物644	5.91
化合物645	<3.00
化合物646	1.77
化合物647	5.62
化合物648	2.04
化合物649	2.69
化合物650	0.95

化合物651	262.90
化合物652	0.72
化合物653	1.10
化合物654	2.03
化合物655	1.58
化合物656	2.98
化合物657	2.63
化合物658	<3.00
化合物659	12.45
化合物660	18.70
化合物661	<10.00
化合物662	3.20
化合物663	136.67
化合物664	15.08
化合物666	31.23
化合物667	30.49
化合物668	9.13
化合物669	15.29
化合物671	<3.00
化合物672	31.18
化合物673	10.13
化合物675	<3.00
化合物676	<3.00
化合物677	<3.00
化合物678	<3.00
化合物679	<3.00
化合物680	4.04

化合物681	25.90
化合物682	12.50
化合物683	<3.00
化合物684	54.25
化合物685	36.43
化合物686	<3.00
化合物687	<3.00
化合物688	<3.00
化合物689	<3.00
化合物690	87.97
化合物691	97.03
化合物692	99.40
化合物693	70.18
化合物694	38.77
化合物695	6.76
化合物696	4.47
化合物697	<3.00
化合物698	<3.00
化合物713	15.49
化合物714	3.52
化合物718	6.91
化合物719	9.59
化合物720	3.51
化合物721	22.34
化合物722	12.84
化合物723	18.03
化合物724	17.08
化合物725	69.40
化合物726	<3.00
化合物728	20.33
化合物729	27.33
化合物730	15.66

化合物731	19.18
化合物732	29.35
化合物733	<10.00
化合物735	18.34
化合物737	4.24
化合物738	7.55
化合物743	14.40
化合物745	6.12
化合物746	16.77
化合物747	11.93
化合物749	9.05
化合物750	<3.00
化合物751	13.11
化合物752	<3.00
化合物753	12.36
化合物754	<3.00
化合物756	10.33
化合物757	18.84
化合物763	11.18
化合物764	5.92
化合物765	6.88
化合物768	10.62
化合物769	4.44
化合物770	16.49

【0930】

【表 4】

化合物番号	阻害(%) (300 μ M)
化合物2	77.30
化合物131	32.40
化合物230	50.42
化合物231	32.76
化合物232	44.92
化合物233	33.62
化合物234	37.88
化合物235	47.92
化合物236	49.42
化合物237	33.12
化合物238	30.58
化合物239	59.08
化合物240	37.92
化合物241	46.94
化合物242	37.61
化合物243	50.17
化合物244	30.72
化合物245	31.68
化合物246	32.62
化合物247	34.81
化合物248	30.30
化合物249	41.59
化合物250	37.86
化合物251	31.22
化合物357	65.82
化合物366	69.87
化合物471	50.99
化合物523	50.09
化合物524	42.75
化合物525	38.89

化合物526	40.24
化合物527	40.94
化合物528	58.38
化合物529	80.96
化合物530	38.16
化合物531	35.68
化合物532	76.00
化合物533	36.87
化合物534	43.82
化合物535	52.98
化合物536	88.25
化合物537	82.05
化合物538	30.31
化合物539	88.39
化合物540	38.41
化合物541	32.16
化合物542	41.11
化合物543	30.2
化合物544	60.05
化合物545	88.81
化合物546	85.19
化合物547	66.61
化合物548	85.72
化合物549	85.10
化合物550	78.88
化合物665	82.34
化合物670	70.17
化合物674	85.12
化合物699	58.35
化合物700	40.28

化合物701	53.98
化合物702	49.17
化合物703	57.92
化合物704	46.62
化合物705	44.68
化合物706	47.79
化合物707	41.22
化合物708	42.04
化合物709	59.36
化合物710	83.13
化合物711	81.04
化合物712	48.73
化合物715	84.11
化合物716	85.77
化合物717	53.54
化合物727	67.74
化合物734	64.91
化合物736	61.49
化合物739	58.89
化合物740	58.55
化合物741	50.93
化合物742	77.57
化合物744	83.71
化合物748	56.45
化合物755	67.27
化合物758	58.21
化合物759	63.85
化合物760	73.34
化合物761	46.24
化合物762	52.08
化合物766	81.89
化合物767	81.83

化合物771	85.12
化合物772	67.72
化合物773	53.91
化合物774	58.85
化合物775	44.62
化合物776	49.19
化合物777	34.17
化合物778	39.12
化合物779	51.64
化合物780	47.74
化合物781	51.18
化合物782	86.76
化合物783	88.84
化合物784	88.49
化合物785	39.53

【0931】

薬理試験例 2 : ウサギ空腸刷子縁膜小胞のナトリウム依存性のリン酸取り込み実験

ニュージーランドホワイト雄ラビット7週令（日本国 北山ラベス社より入手）より空腸上皮を採取し、Kanaoka Katai et. al., J. Biochem. 121, 50-55, 1997、Pierce, B. E. et al., Biochemistry 26, 4272-4279, 1987に示されるカルシウム沈殿法にて刷子縁膜小胞を単離した。その後、同サンプルを用いてKanaoka Katai et. al., J. Biochem. 121, 50-55, 1997に示される急速ろ過法によって化合物29および化合物68のリン取り込み阻害活性を ^3H 放射性リン（日本国 第一化学社製）を用いて測定したところ、それぞれの化合物は濃度依存的に阻害活性を示した（図1）。また、同一の実験においてグルコース吸収への非特異的阻害活性を ^14C -グルコース（米国 モラベックバイオケミカル社製）を用いて行ったが、本化合物は阻害活性を示さなかった（図2）。両実験において非特異的取り込みの陰性コントロールとして塩化カルウム添加群を置いた。なお、これ以下のすべて

の試験結果は平均値 ± 標準誤差で表示した。対照群と被験化合物群の有意差検定にはスチューデントの t 検定を用いた。

【0932】

薬理試験例 3 : NaPi-2a を発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性のリン酸取り込み実験

Magagnin S. et.al., Proc Natl Aca Sci USA, 90(13):5979-5983, 1993 に記載されるヒト NaPi-2a の cDNA を PCR 法によりクローニングし、薬理試験例 1 と同様の方法でアフリカツメガエル卵母細胞に NaPi-2a を発現させて、リン取り込み阻害活性を ^{32}P 放射性リンを用いて測定した。その結果、化合物 1 は濃度依存的に NaPi-2a に対して阻害活性を示した (図 3)。また化合物 29 は NaPi-2b のみならず、NaPi-2a に対しても阻害活性を示した (図 4)。なお、非特異的取り込みの陰性コントロールとして塩化コリン (Choline Cl) 添加群とリン酸輸送阻害の陽性コントロールとして PFA (phosphonoformic acid) を置いた。

【0933】

薬理試験例 4 : ^{32}P の腸管からの吸収に対する抑制作用

SD 系ラット (6~7 週齢、日本国 チャールスリバー社より入手) を 3~4 日間低リン食 (リン 0.1% 含有、日本国 オリエンタル酵母社製) で飼育した後、約 24 時間絶食し、実験に供した。 ^{32}P は精製水あるいは液体飼料 (日本国 日本クレア社) で希釈して 0.7~3.5 MBq/ml とし、5 ml/kg の用量で強制経口投与 (経口ゾンデによる胃内への投与) した。化合物あるいは媒体は ^{32}P 投与の 30 分前と ^{32}P 投与と同時の 2 回に分けて 5 ml/kg の用量で強制経口投与した。 ^{32}P 投与の 30 分後、45 分後あるいは 60 分後に尾動脈から採血し、液体シンチレーションカウンタにより血中 ^{32}P 放射活性を測定し、血中放射活性の増加抑制を腸管からのリンの吸収抑制の指標とした。

【0934】

結果は下記式により抑制率で示した。

【数 1】

$$\frac{(\text{媒体投与群の血中放射活性} - \text{化合物投与群の血中放射活性})}{\text{媒体投与群の血中放射活性}} \times 100$$

また、血中放射活性の平均値の差の有意検定は t 検定により行った。

その結果、表 5 に示すように、各化合物は腸管からのリン吸収を有意に抑制した。

【0935】

【表 5】

表 3 : ^{32}P の腸管からの吸収に対する抑制作用

化合物	用量 (mg/kg)	血中放射活性抑制率 (%)
9 1	320	28.3
9 2	160	25.5
8 8	400	29.1
1 6 3	360	57.8
1 3 0	270	22.8
1 5 7	320	20.7
1 6 4	400	55.0
1 6 5	400	27.6
2 5 2	400	29.2
2 5 3	400	39.0
2 5 4	400	68.4
3 1 5	100	42.4
3 7 2	100	63.7
2 8 5	80	60.3

すべての化合物で $p < 0.05$ で媒体投与群と比較し有意な差を認めた。

【図面の簡単な説明】

【図 1】

本発明による化合物によるウサギ空腸刷子縁膜小胞のナトリウム依存性リン酸取り込みの阻害を示した図である。

【図 2】

本発明による化合物によるウサギ空腸刷子縁膜小胞のナトリウム依存性グルコース取り込みの阻害を示した図である。

【図 3】

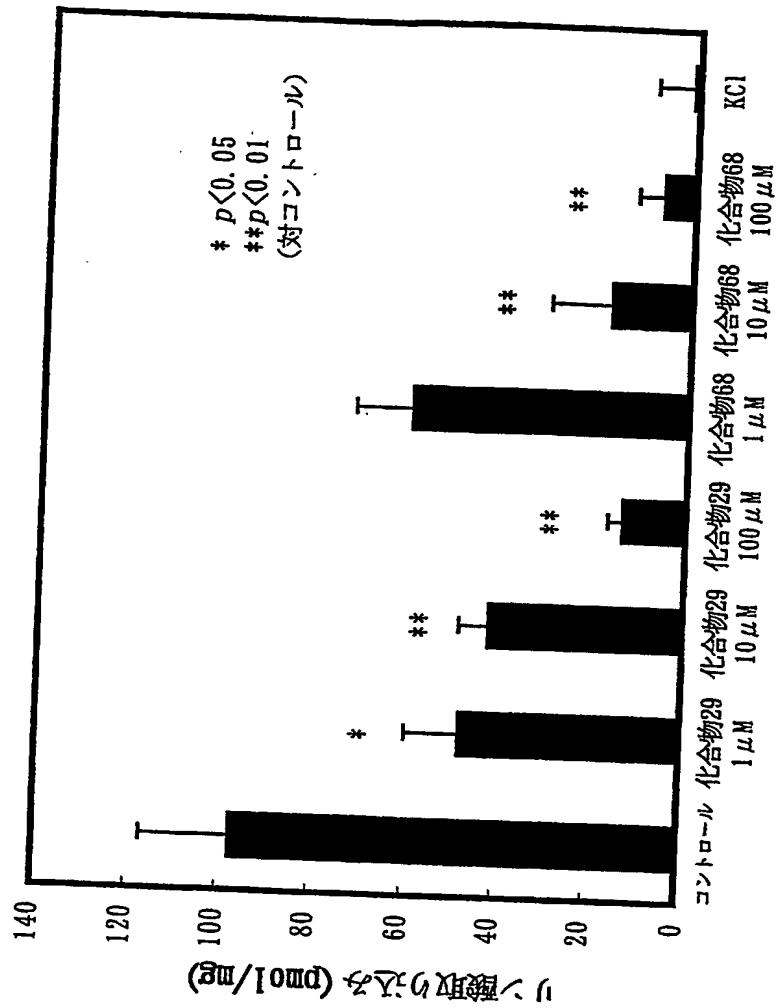
本発明による化合物による NaPi-2a を発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性リン酸取り込みの阻害を示した図である。

【図 4】

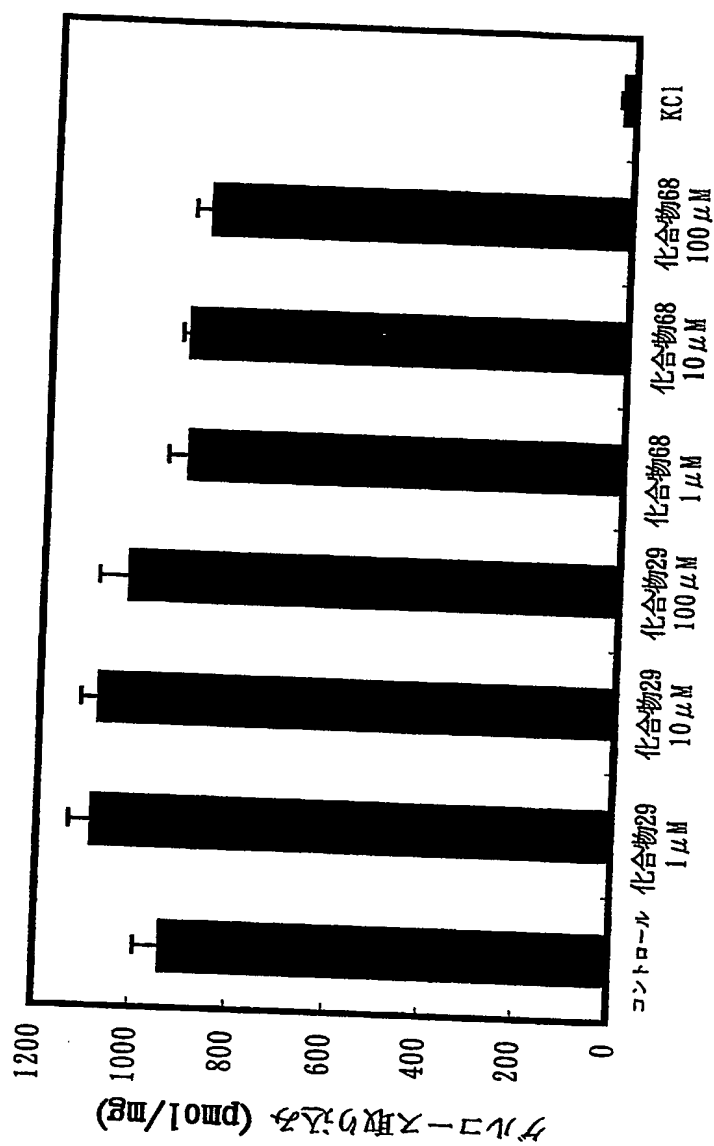
本発明による化合物による NaPi-2a および NaPi-2b を発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性リン酸取り込みの阻害を示した図である。

【書類名】 図面

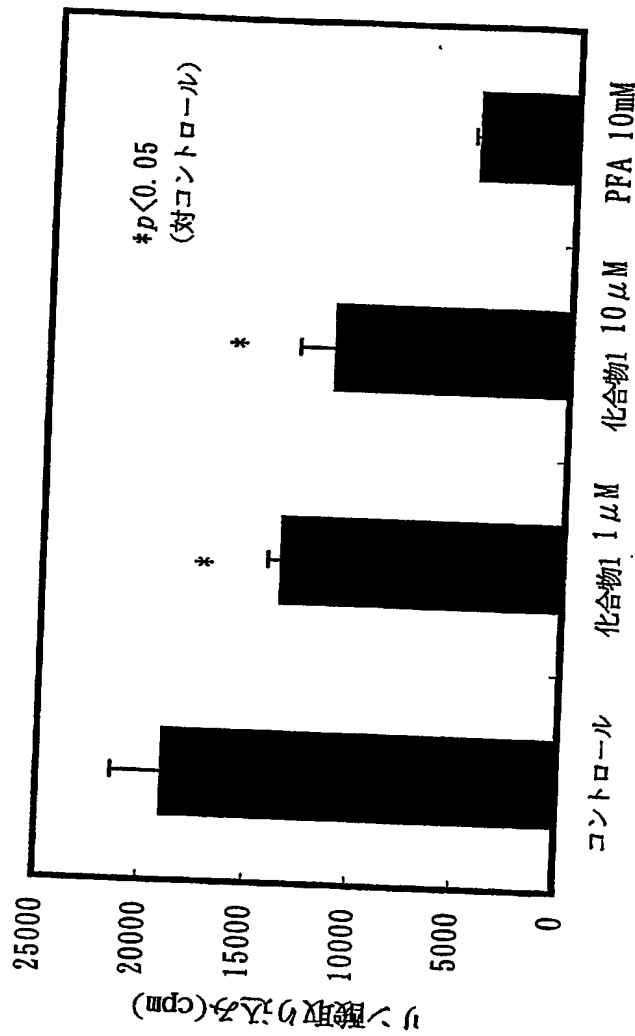
【図 1】



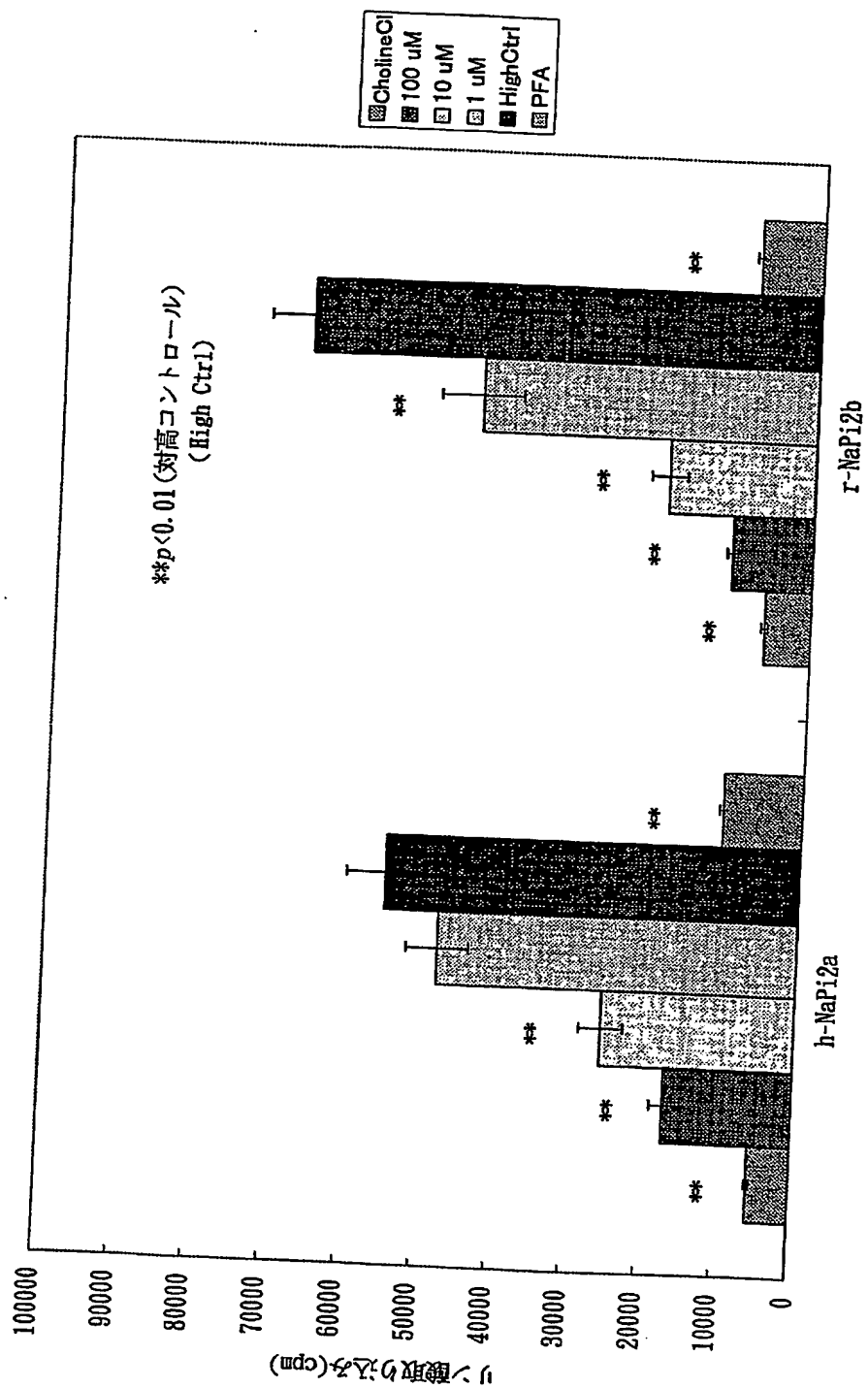
【図 2】



【図 3】



【図4】



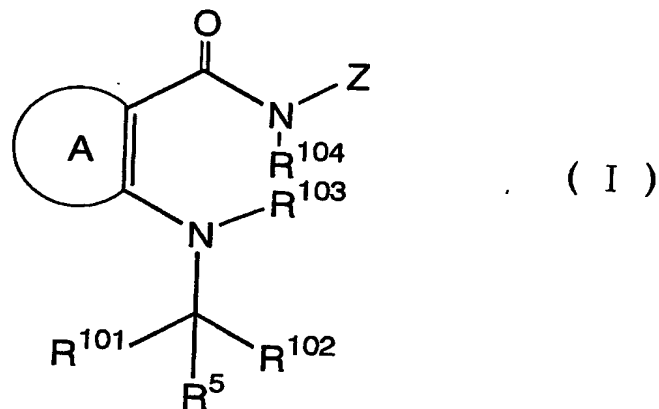
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 従来と異なる機構により血清中のリン濃度を効果的に抑制することにより、血清中のリン酸濃度の上昇により生ずる疾患を効果的に予防または治療できる化合物およびそれを含んでなる医薬組成物の提供。

【解決手段】 式(I)の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物。

【化1】



(式中Aは置換可能な炭素環部分または複素環部分を表し、R⁵は置換可能なアルキル、置換可能なアリール、置換可能な複素環式基等を表し、Zは-N=C R⁶ R⁷または-NH-C R⁶ R⁷ R¹⁷を表し、R⁶、R⁷、R¹⁷は各々H、置換可能なアルキル、置換可能なアリール、置換可能な複素環式基等を表す。)

【選択図】 なし

特願 2003-089173

出願人履歴情報

識別番号

[000253503]

1. 変更年月日

1995年 6月14日

[変更理由]

住所変更

住所

東京都中央区新川二丁目10番1号

氏名

麒麟麦酒株式会社